

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES  
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
15. Februar 2001 (15.02.2001)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
**WO 01/10863 A2**

(51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>: C07D 409/12,  
A01N 43/66, 43/54

Ackerweg 9, D-40789 Monheim (DE). PONTZEN, Rolf  
[DE/DE]; Am Kloster 69, D-42799 Leichlingen (DE).

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP00/07096

(74) Gemeinsamer Vertreter: BAYER AKTIENGE-  
SELLSCHAFT; D-51368 Leverkusen (DE).

(22) Internationales Anmeldedatum:  
25. Juli 2000 (25.07.2000)

(81) Bestimmungsstaaten (*national*): AE, AG, AL, AM, AT,  
AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CR, CU,  
CZ, DE, DK, DM, DZ, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM,  
HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK,  
LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX,  
MZ, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL,  
TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW.

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:  
199 37 118.0 6. August 1999 (06.08.1999) DE

(84) Bestimmungsstaaten (*regional*): ARIPO-Patent (GH,  
GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), eura-  
sisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM),  
europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI,  
FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI-Patent  
(BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE,  
SN, TD, TG).

(71) Anmelder (*für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme  
von US*): BAYER AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE];  
D-51368 Leverkusen (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (*nur für US*): GESING, Ernst,  
Rudolf, F. [DE/DE]; Trillser Graben 4, D-40699  
Erkrath-Hochdahl (DE). KLUTH, Joachim [DE/DE];  
Virneburgstrasse 69, D-40764 Langenfeld (DE).  
MÜLLER, Klaus-Helmut [AT/DE]; Solfstrasse 19,  
D-40593 Düsseldorf (DE). DREWES, Mark, Wil-  
helm [DE/DE]; Goethestrasse 38, D-40764 Langenfeld  
(DE). DAHMEN, Peter [DE/DE]; Altebrückerstrasse  
63, D-41470 Neuss (DE). FEUCHT, Dieter [DE/DE];

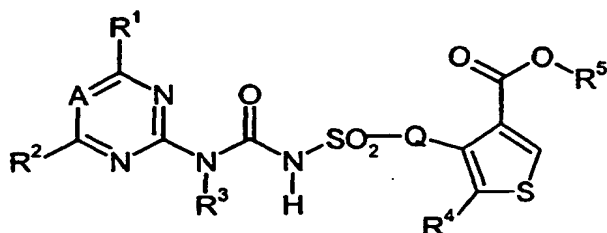
Veröffentlicht:

— Ohne internationalen Recherchenbericht und erneut zu  
veröffentlichen nach Erhalt des Berichts.

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes, und der anderen  
Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on  
Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe  
der PCT-Gazette verwiesen.

(54) Title: SUBSTITUTED THIENYL(AMINO)SULFONYLUREAS

(54) Bezeichnung: SUBSTITUIERTE THIENYL(AMINO)SULFONYLHARNSTOFFE



(I)

(57) Abstract: The invention relates  
to thienyl(amino)sulfonylureas of  
formula (I), wherein A, Q, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>,  
R<sup>4</sup> and R<sup>5</sup> have the meaning given in  
the description, and to a method for the  
preparation of said compounds and their  
use as herbicides.

(57) Zusammenfassung: Die  
Erfindung betrifft neue substituierte  
Thienyl(amino)sulfonylharnstoffe der  
allgemeinen Formel (I), in welcher  
A, Q, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> die in der Beschreibung angegebene Bedeutung haben, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre  
Verwendung als Herbizide.

WO 01/10863 A2

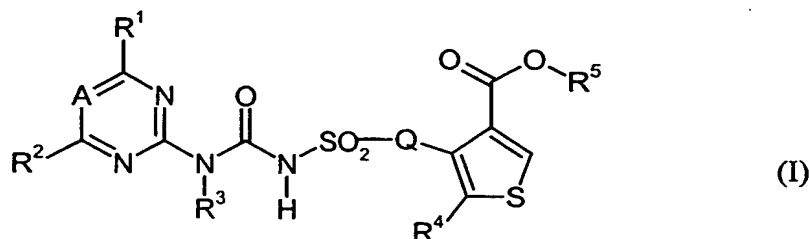
**THIS PAGE BLANK (USPTO)**

Substituierte Thienyl(amino)sulfonylharnstoffe

Die Erfindung betrifft neue substituierte Thienyl(amino)sulfonylharnstoffe, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Herbizide.

Es ist bereits bekannt, daß bestimmte substituierte Thienylsulfonylharnstoffe herbizide Eigenschaften aufweisen (vgl. EP-A-30142 / US-A-4481029 / US-A-4599103 / US-A-4701535, EP-A-97122 / US-A-4549898, EP-A-207609 / US-A-4668281). Die herbizide Wirksamkeit dieser bekannten Verbindungen ist jedoch nicht in allen Belangen zufriedenstellend.

Es wurden nun die neuen substituierten Thienyl(amino)sulfonylharnstoffe der allgemeinen Formel (I)



in welcher

A für Stickstoff oder eine CH-Gruppierung steht,

20

Q für eine Einfachbindung oder für NH steht,

R<sup>1</sup> für Wasserstoff, Halogen oder jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylamino, Dialkylamino, Aryloxy oder Heterocycl-  
oxy steht,

25

- R<sup>2</sup> für Wasserstoff, Halogen oder jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylamino, Dialkylamino, Aryloxy oder Heterocycl-  
oxy steht,
- 5 R<sup>3</sup> für Wasserstoff oder gegebenenfalls substituiertes Alkyl steht,
- R<sup>4</sup> für Halogen oder gegebenenfalls substituiertes Alkyl steht und - für den Fall, daß Q für NH steht - auch für Wasserstoff steht, und
- 10 R<sup>5</sup> für Wasserstoff oder jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl oder Heterocyclyl steht,

sowie Salze von Verbindungen der Formel (I) gefunden.

- 15 Gesättigte oder ungesättigte Kohlenwasserstoffgruppierungen, wie Alkyl, Alkenyl oder Alkynyl, sind - auch in Verknüpfungen mit Heteroatomen, wie in Alkoxy - soweit möglich jeweils geradkettig oder verzweigt.

- Gegebenenfalls substituierte Reste können einfach oder mehrfach substituiert sein, wobei bei Mehrfachsubstitution die Substituenten gleich oder verschieden sein können.
- 20

Bevorzugte Substituenten bzw. Bereiche der in den oben und nachstehend aufgeführten Formeln vorhandenen Reste werden im folgenden definiert.

25

- A steht bevorzugt für Stickstoff oder eine CH-Gruppierung.
- Q steht bevorzugt für eine Einfachbindung oder für NH.
- 30 R<sup>1</sup> steht bevorzugt für Wasserstoff, für Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkoxy,

Alkylthio, Alkylamino oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy substituiertes Phenoxy, Oxetanyloxy, Furyloxy oder Tetrahydrofuryloxy.

5

R<sup>2</sup> steht bevorzugt für Wasserstoff, für Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylamino oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy substituiertes Phenoxy, Oxetanyloxy, Furyloxy oder Tetrahydrofuryloxy.

10

R<sup>3</sup> steht bevorzugt für Wasserstoff oder gegebenenfalls durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl-carbonyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl substituiertes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen.

15

R<sup>4</sup> steht bevorzugt für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen steht und - für den Fall, daß Q für NH steht - auch für Wasserstoff.

20

R<sup>5</sup> steht bevorzugt für Wasserstoff, für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkenyl oder Alkinyl mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl substituiertes Cycloalkyl oder Cycloalkylalkyl mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Cycloalkylgruppen und gegebenenfalls 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy substituiertes Oxetanyl, Furyl oder Tetrahydrofuryl.

25

30

A steht besonders bevorzugt für Stickstoff oder eine CH-Gruppierung.

- Q steht besonders bevorzugt für eine Einfachbindung oder für NH.
- 5 R<sup>1</sup> steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino oder Diethylamino.
- 10 R<sup>2</sup> steht besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino oder Diethylamino.
- 15 R<sup>3</sup> steht besonders bevorzugt für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls durch Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Acetyl, Propionyl, n- oder i-Butyryl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl substituiertes Methyl oder Ethyl.
- 20 R<sup>4</sup> steht besonders bevorzugt für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl.
- 25 R<sup>5</sup> steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Propenyl, Butenyl, Propinyl oder Butinyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl,
- 30

Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl oder Cyclohexylmethyl.

- 5           A       steht ganz besonders bevorzugt für Stickstoff oder eine CH-Gruppierung.
- Q       steht ganz besonders bevorzugt für eine Einfachbindung oder für NH.
- 10          R<sup>1</sup>      steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, für  
              jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy sub-  
              stituiertes Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methyl-  
              amino, Ethylamino, oder für Dimethylamino.
- 15          R<sup>2</sup>      steht ganz besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, für jeweils gege-  
              benenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl,  
              Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methylamino oder Ethyl-  
              amino, oder für Dimethylamino.
- 20          R<sup>3</sup>      steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff oder Methyl.
- R<sup>4</sup>      steht ganz besonders bevorzugt für jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder  
              Chlor substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl.
- 25          R<sup>5</sup>      steht ganz besonders bevorzugt für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor,  
              Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, oder für  
              jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes Propenyl oder  
              Propinyl.
- A       steht am meisten bevorzugt für eine CH-Gruppierung.
- 30          R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> stehen am meisten bevorzugt für Methoxy.

$R^3$  steht am meisten bevorzugt für Wasserstoff.

5 Gegenstand der Erfindung sind vorzugsweise auch die Natrium-, Kalium-, Magnesium-, Calcium-, Ammonium-,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl-ammonium-, Di- $(C_1$ - $C_4$ -alkyl)-ammonium-, Tri- $(C_1$ - $C_4$ -alkyl)-ammonium-, Tetra- $(C_1$ - $C_4$ -alkyl)-ammonium-, Tri- $(C_1$ - $C_4$ -alkyl)-sulfonium-,  $C_5$ - oder  $C_6$ -Cycloalkyl-ammonium- und Di- $(C_1$ - $C_2$ -alkyl)-benzyl-ammonium-Salze von Verbindungen der Formel (I), in welcher A, Q,  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$  und  $R^5$  die oben vorzugsweise angegebene Bedeutung haben.

10 Die oben aufgeführten allgemeinen oder in Vorzugsbereichen angegebenen Restdefinitionen gelten sowohl für die Endprodukte der Formel (I) als auch entsprechend für die jeweils zu Herstellung benötigten Ausgangsstoffe bzw. Zwischenprodukte. Diese Restdefinitionen können untereinander, also auch zwischen den angegebenen Bereichen bevorzugter Verbindungen, beliebig kombiniert werden.

15 Erfindungsgemäß bevorzugt sind diejenigen Verbindungen der Formel (I), bei welchen eine Kombination der vorstehend als bevorzugt aufgeführten Bedeutungen vorliegt.

20 Erfindungsgemäß besonders bevorzugt sind diejenigen Verbindungen der Formel (I), bei welchen eine Kombination der vorstehend als besonders bevorzugt aufgeführten Bedeutungen vorliegt.

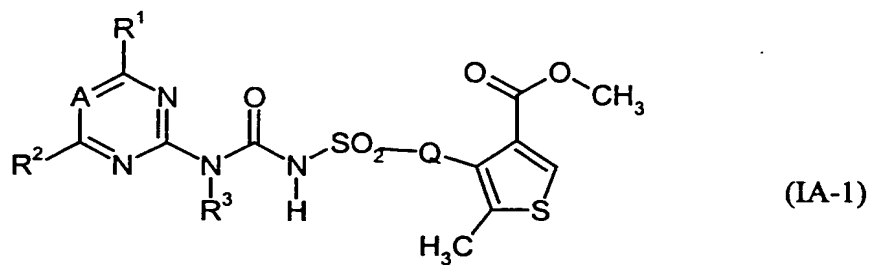
25 Erfindungsgemäß ganz besonders bevorzugt sind diejenigen Verbindungen der Formel (I), bei welchen eine Kombination der vorstehend als ganz besonders bevorzugt aufgeführten Bedeutungen vorliegt.

Erfindungsgemäß am meisten bevorzugt sind die Verbindungen, bei denen  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$  oder A eine der als am meisten bevorzugt ausgeführte Bedeutung bestehen.



Beispiele für die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) sind in den nachstehenden Gruppen aufgeführt.


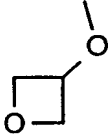
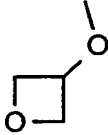
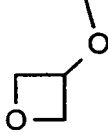
Gruppe 1

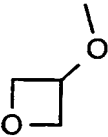


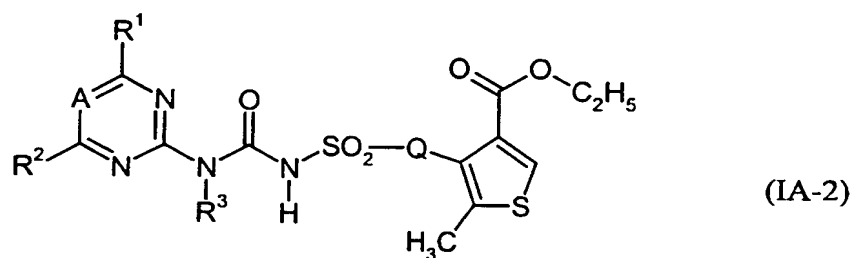
5

A, Q, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> haben darin beispielhaft die nachstehend aufgeführte Bedeutung:

| A  | Q  | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>   | R <sup>3</sup>  |
|----|----|------------------|------------------|-----------------|
| CH | -  | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | H               |
| CH | NH | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | H               |
| CH | -  | CH <sub>3</sub>  | OCH <sub>3</sub> | H               |
| CH | NH | CH <sub>3</sub>  | OCH <sub>3</sub> | H               |
| CH |    | CH <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub>  | H               |
| CH | NH | CH <sub>3</sub>  | CH <sub>3</sub>  | H               |
| CH | -  | Cl               | OCH <sub>3</sub> | H               |
| CH | -  | H                | CH <sub>3</sub>  | H               |
| N  | -  | CH <sub>3</sub>  | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> |
| N  | -  | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> |
| N  | -  | CH <sub>3</sub>  | OCH <sub>3</sub> | H               |

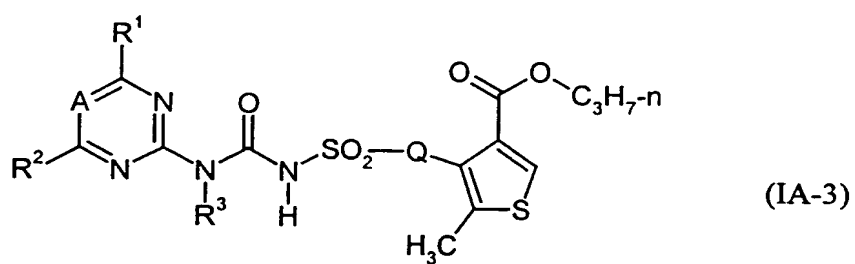
| A  | Q  | R <sup>1</sup>                | R <sup>2</sup>  | R <sup>3</sup> |
|----|----|-------------------------------|---|----------------|
| N  | NH | CH <sub>3</sub>               | OCH <sub>3</sub>  | H              |
| N  | -  | OCH <sub>3</sub>              | OCH <sub>3</sub>  | H              |
| N  | NH | OCH <sub>3</sub>              | OCH <sub>3</sub>  | H              |
| N  | -  | CH <sub>3</sub>               | CH <sub>3</sub>   | H              |
| N  | -  | OCHF <sub>2</sub>             | N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | H              |
| N  | -  | CH <sub>3</sub>               | SCH <sub>3</sub>  | H              |
| N  | -  | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | OCH <sub>3</sub>  | H              |
| N  | -  | CH <sub>3</sub>               | OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>  | H              |
| N  | -  | H                             | OCH <sub>3</sub>  | H              |
| N  | -  | OCH <sub>3</sub>              |  | H              |
| N  | -  | CH <sub>3</sub>               | N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | H              |
| CH | -  | OCH <sub>3</sub>              |  | H              |
| CH | -  | CH <sub>3</sub>               |  | H              |
| CH | -  | Cl                            |  | H              |

| A | Q | R <sup>1</sup>                   | R <sup>2</sup>  | R <sup>3</sup> |
|---|---|----------------------------------|---|----------------|
| N | - | H                                |  | H              |
| N | - | N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | H              |

Gruppe 2

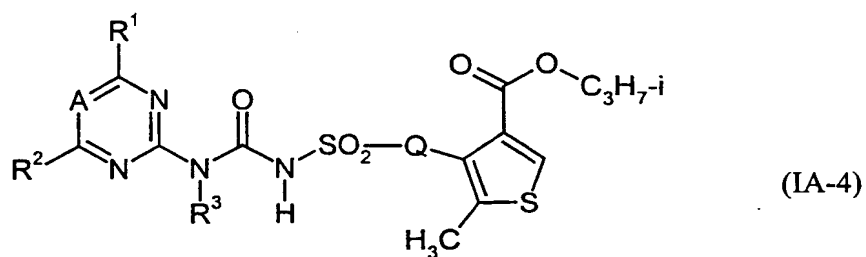
A, Q, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebene Bedeutung.

5

Gruppe 3

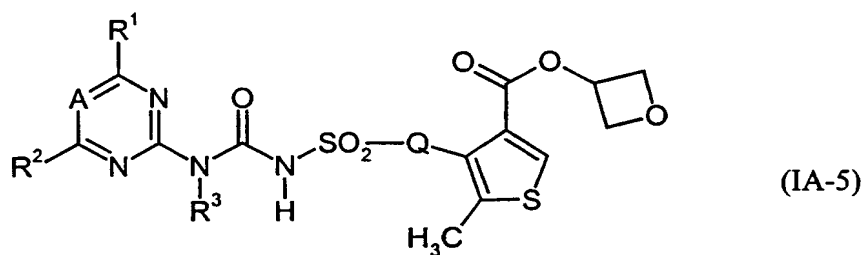
A, Q, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebene Bedeutung.

10

Gruppe 4

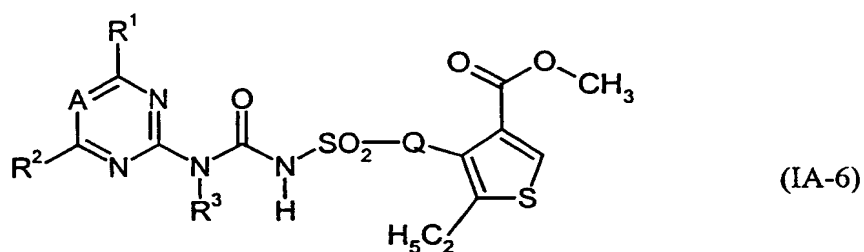
A, Q, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebene Bedeutung.

5

Gruppe 5

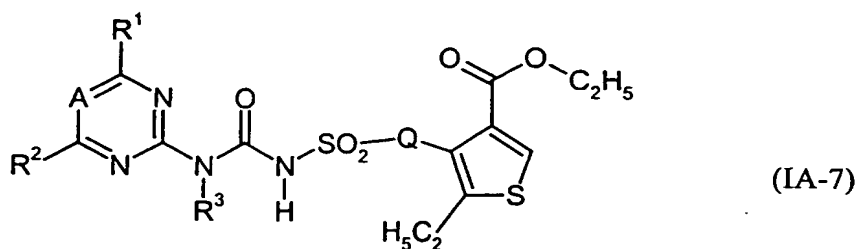
A, Q, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebene Bedeutung.

10

Gruppe 6

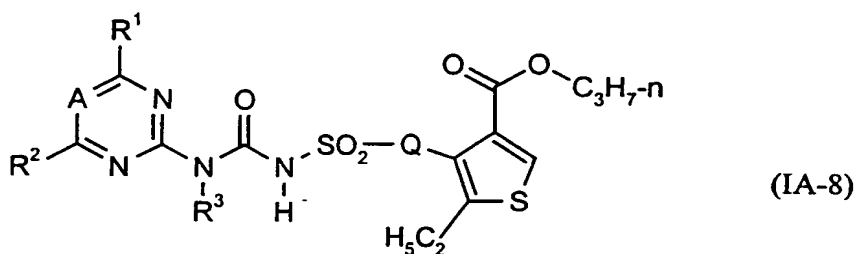
A, Q, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebene Bedeutung.

15

Gruppe 7

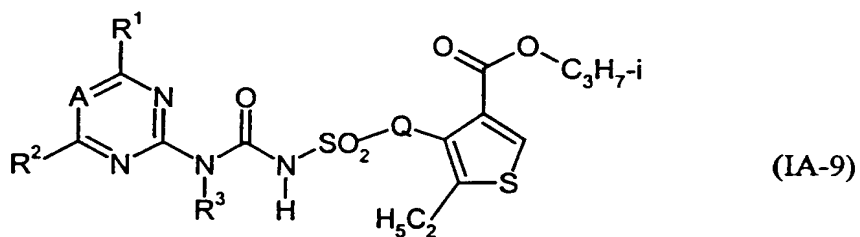
A, Q, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebene Bedeutung.

5

Gruppe 8

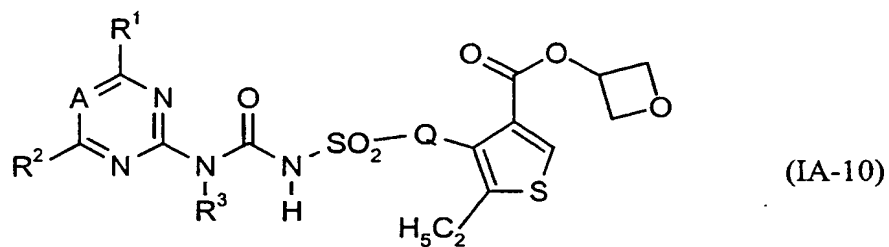
A, Q, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebene Bedeutung.

10

Gruppe 9

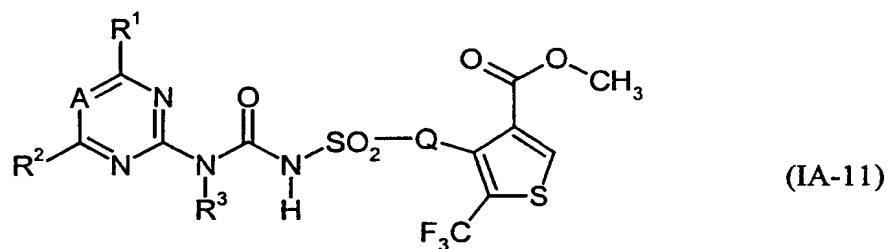
A, Q, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebene Bedeutung.

15

Gruppe 10

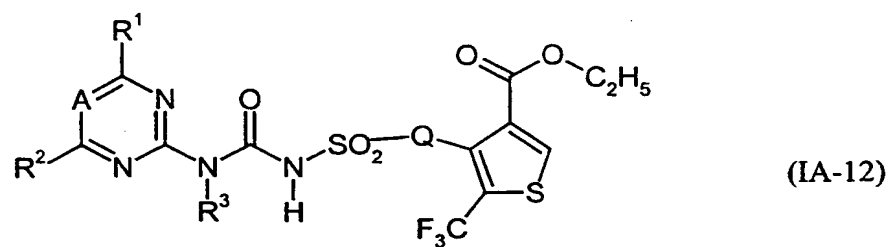
A, Q, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebene Bedeutung.

5

Gruppe 11

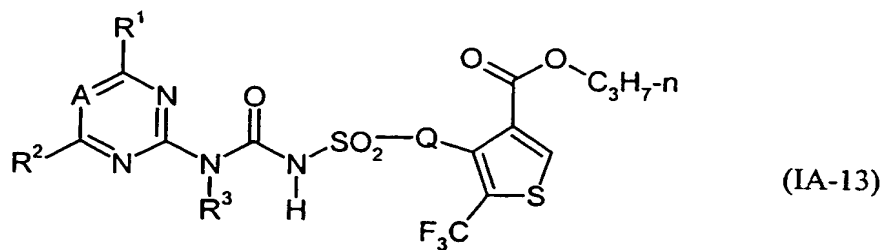
A, Q, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebene Bedeutung.

10

Gruppe 12

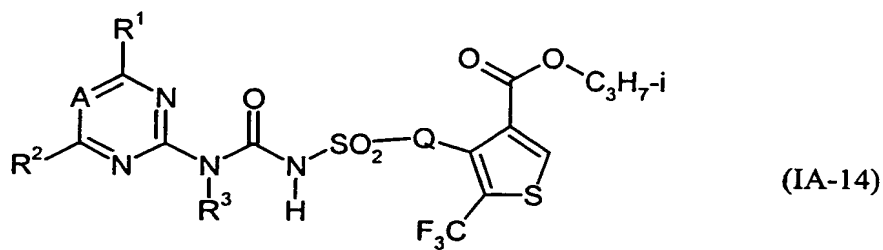
A, Q, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebene Bedeutung.

15

Gruppe 13

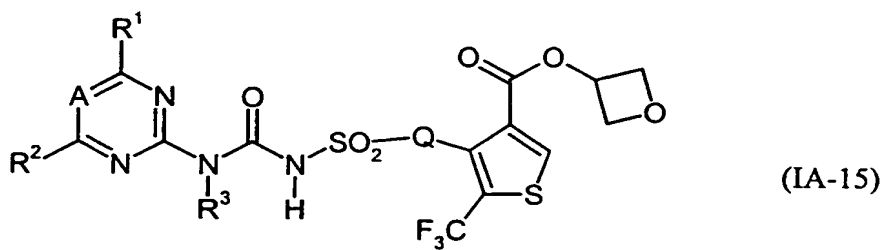
A, Q, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebene Bedeutung.

5

Gruppe 14

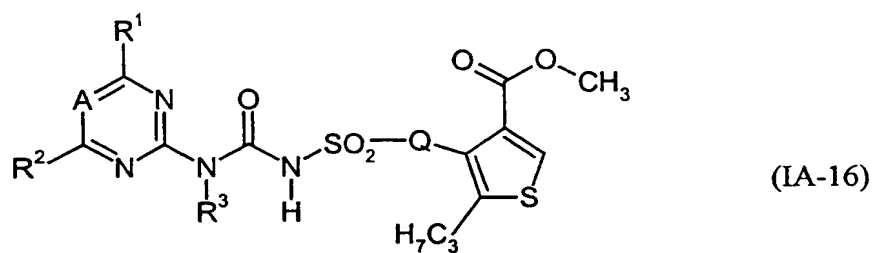
A, Q, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebene Bedeutung.

10

Gruppe 15

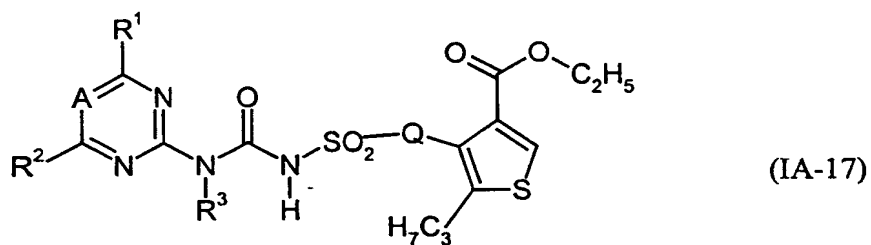
A, Q, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebene Bedeutung.

15

Gruppe 16

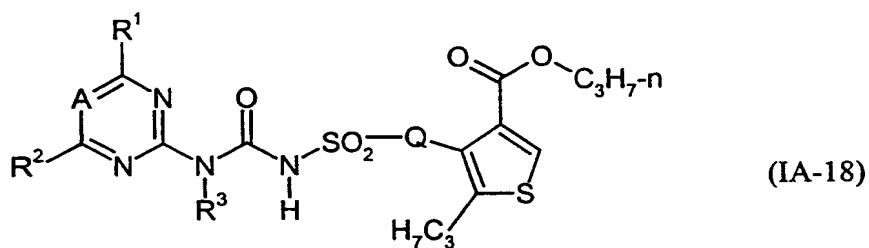
A, Q, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebene Bedeutung.

5

Gruppe 17

A, Q, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebene Bedeutung.

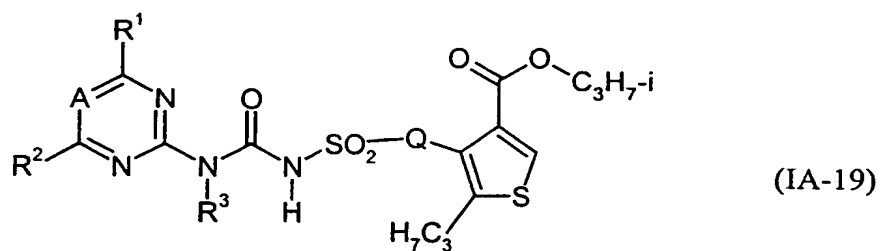
10

Gruppe 18

A, Q, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebene Bedeutung.

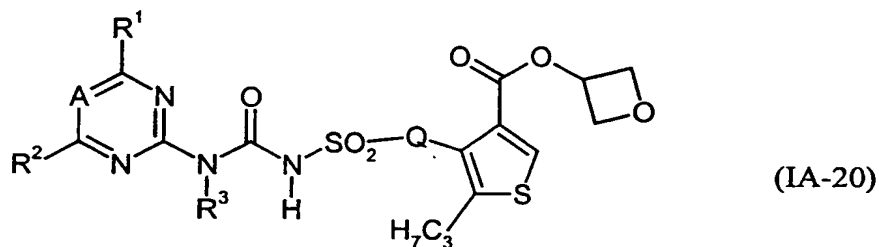
15



Gruppe 19

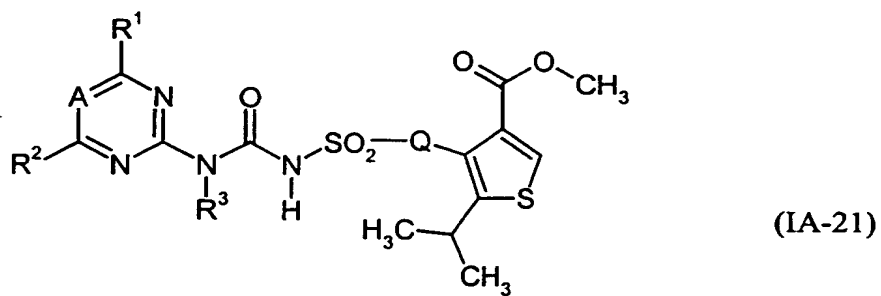
A, Q, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebene Bedeutung.

5

Gruppe 20

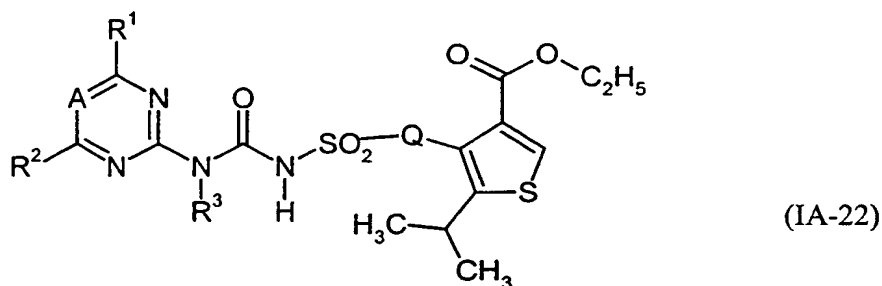
A, Q, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebene Bedeutung.

10

Gruppe 21

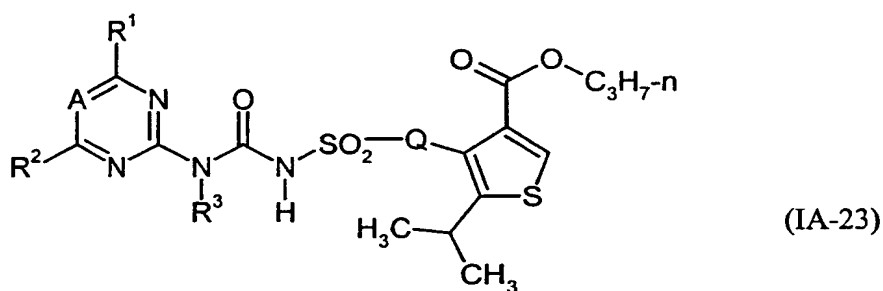
A, Q, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebene Bedeutung.

15

Gruppe 22

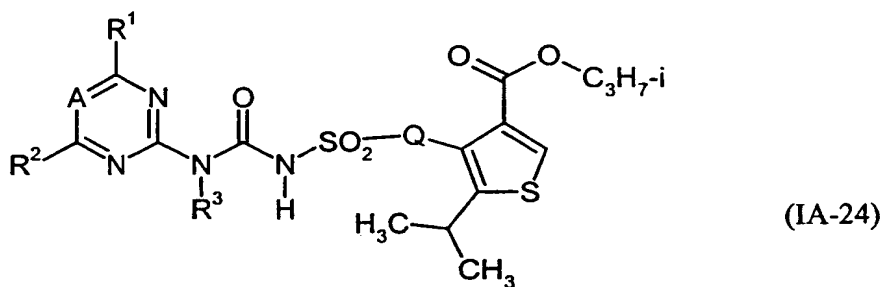
A, Q, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebene Bedeutung.

5

Gruppe 23

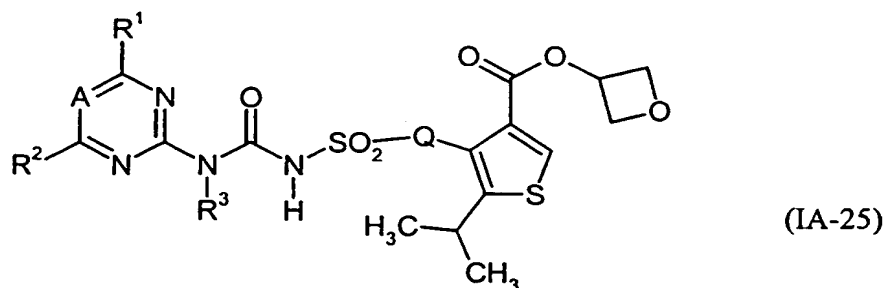
A, Q, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebene Bedeutung.

10

Gruppe 24

A, Q, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebene Bedeutung.

15

Gruppe 25

A, Q, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebene Bedeutung.

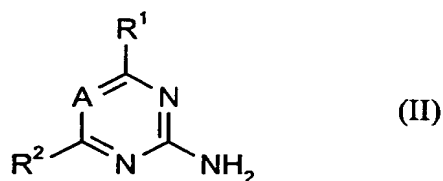
5

Die neuen substituierten Thienyl(amino)sulfonylharnstoffe der allgemeinen Formel (I) zeichnen sich durch starke herbizide Wirksamkeit aus.

Man erhält die neuen substituierten Thienyl(amino)sulfonylharnstoffe der allgemeinen Formel (I), wenn man

10

(a) Aminoazine der allgemeinen Formel (II)

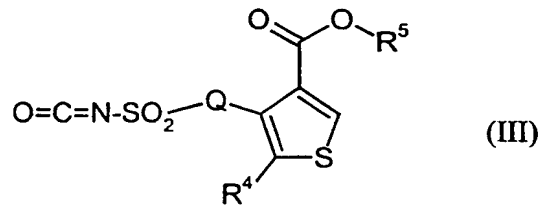


15 in welcher

A, R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> die oben angegebene Bedeutung haben,

mit Thienyl(amino)sulfonylisocyanaten der allgemeinen Formel (III)

20



in welcher

Q, R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> die oben angegebene Bedeutung haben,

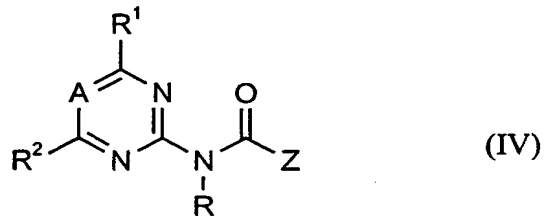
5

gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

oder wenn man

10

(b) substituierte Aminoazine der allgemeinen Formel (IV)



in welcher

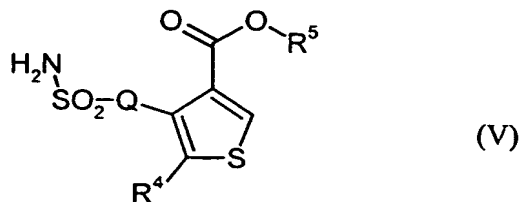
15

A, R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> die oben angegebene Bedeutung haben,

Z für Halogen, Alkoxy oder Aryloxy steht und

20 R die oben für R<sup>3</sup> angegebene Bedeutung hat oder für die Gruppierung -C(O)-Z steht,

mit Thiophenderivaten der allgemeinen Formel (V)



in welcher

Q, R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> die oben angegebene Bedeutung haben,

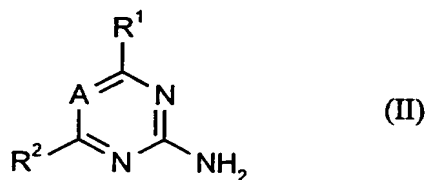
5

gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt,

oder wenn man

10

(c) Aminoazine der allgemeinen Formel (II)

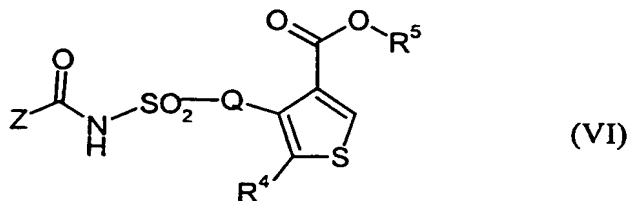


in welcher

15

A, R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> die oben angegebene Bedeutung haben,

mit Thiophenderivaten der allgemeinen Formel (VI)



20

in welcher

Q, R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> die oben angegebene Bedeutung haben und

Z für Halogen, Alkoxy oder Aryloxy steht,

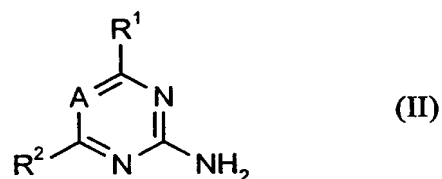
5

gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt,

oder wenn man

10

(d) Aminoazine der allgemeinen Formel (II)



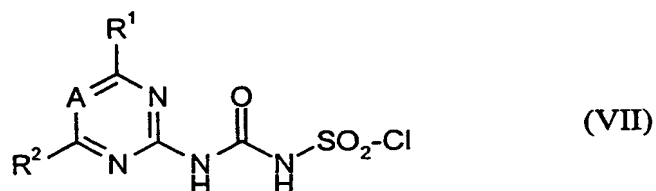
in welcher

15

A, R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> die oben angegebene Bedeutung haben,

mit Chlorsulfonylisocyanat gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt und die hierbei gebildeten Chlorsulfonylaminocarbonylamino-azine der allgemeinen Formel (VII)

20



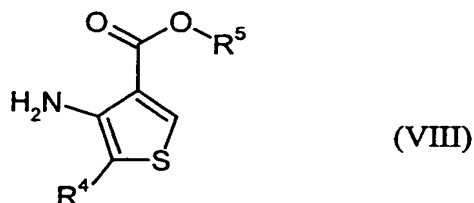
in welcher

A, R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> die oben angegebene Bedeutung haben,

25

- nach Zwischenisolierung oder „in situ“ -

mit substituierten Aminothiophenen der allgemeinen Formel (VIII)



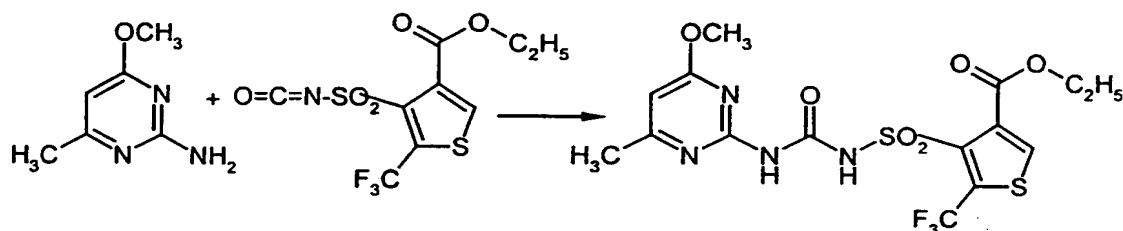
in welcher

$R^4$  und  $R^5$  die oben angegebene Bedeutung haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt,

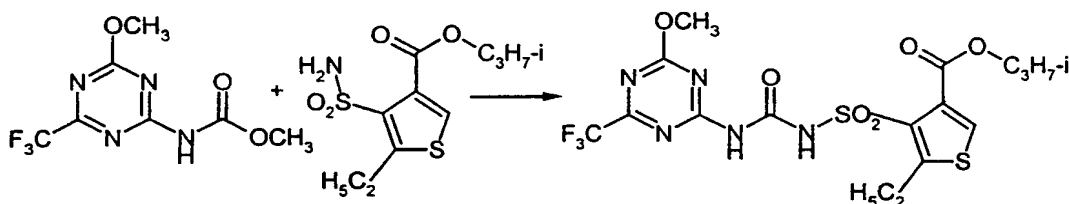
und gegebenenfalls die nach den Verfahren (a), (b), (c) oder (d) erhaltenen Verbindungen der Formel (I) nach üblichen Methoden in Salze überführt.

Verwendet man beispielsweise 2-Amino-4-methoxy-6-methyl-pyrimidin und 4-Ethoxycarbonyl-2-trifluormethyl-thien-3-yl-sulfonylisocyanat als Ausgangsstoffe, so kann der Reaktionsablauf beim erfindungsgemäßen Verfahren (a) durch das folgende Formelschema skizziert werden:

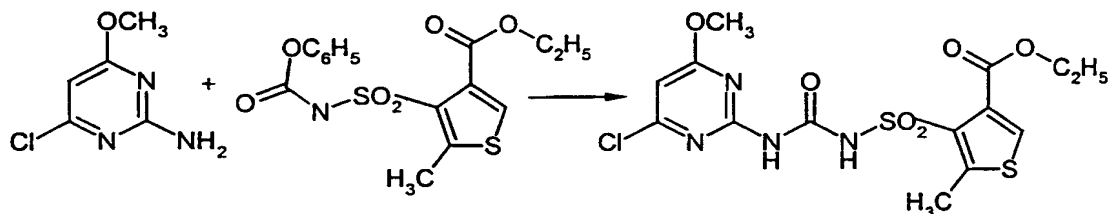


Verwendet man beispielsweise 2-Methoxycarbonylamino-4-methoxy-6-trifluormethyl-1,3,5-triazin und 2-Ethyl-4-i-propoxycarbonyl-thiophen-3-sulfonamid als

Ausgangsstoffe, so kann der Reaktionsablauf beim erfindungsgemäßen Verfahren (b) durch das folgende Formelschema skizziert werden:



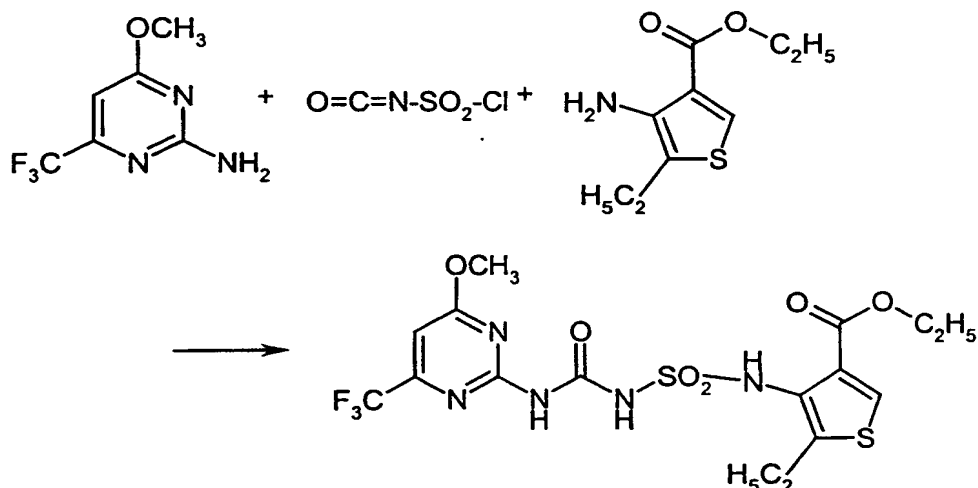
- 5 Verwendet man beispielsweise 2-Amino-4-chlor-6-methoxy-pyrimidin und N-(4-Ethoxycarbonyl-2-methyl-thien-3-yl-sulfonyl)-O-phenyl-urethan als Ausgangsstoffe, so kann der Reaktionsablauf beim erfindungsgemäßen Verfahren (c) durch das folgende Formelschema skizziert werden:



10

- Verwendet man beispielsweise 2-Amino-4-methoxy-6-trifluormethyl-pyrimidin, Chlorsulfonylisocyanat und 3-Amino-2-ethyl-thiophen-4-carbonsäure-ethylester als Ausgangsstoffe, so kann der Reaktionsablauf beim erfindungsgemäßen Verfahren (d) durch das folgende Formelschema skizziert werden:

15





Die bei den erfindungsgemäßen Verfahren (a), (c) und (d) zur Herstellung der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als Ausgangsstoffe zu verwendenden Aminoazine sind durch die Formel (II) allgemein definiert. In der Formel (II) haben A, R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für A, R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> angegeben wurden.

Die Aminoazine der Formel (II) sind bekannte, zum Teil im Handel erhältliche Synthesekemikalien.

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (a) weiter als Ausgangsstoffe zu verwendenden Thienyl(amino)sulfonylisocyanate sind durch die Formel (III) allgemein definiert. In der Formel (III) haben Q, R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für Q, R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> angegeben wurden.

Die Ausgangsstoffe der Formel (III) sind bekannt und/oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden (vgl. EP 30142 / US-A-4481029 / US-A-4599103 / US-A-4701535).

Man erhält die Thienyl(amino)sulfonylisocyanate der Formel (III), wenn man Thiophenderivate der allgemeinen Formel (V) - oben - mit Phosgen bzw. Thiophosgen, gegebenenfalls in Gegenwart eines Alkylisocyanats, wie z.B. Butylisocyanat, gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels, wie z.B. Diazabicyclo[2.2.2]-octan, und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, wie z.B. Toluol, Xylol oder Chlorbenzol, bei Temperaturen zwischen 80°C und 150°C umsetzt und nach Ende der Umsetzung die flüchtigen Komponenten unter vermindertem Druck abdestilliert.

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (b) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) als Ausgangsstoffe zu verwendenden substituierten Aminoazine sind

durch die Formel (IV) allgemein definiert. In der Formel (IV) haben A, R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für A, R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> angegeben wurden; Z steht vorzugsweise für Fluor, Chlor, Brom, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder Phenoxy, insbesondere für Chlor, Methoxy, Ethoxy oder Phenoxy.

Die Ausgangsstoffe der Formel (IV) sind bekannt und/oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden (vgl. US 4690707, DE 19501174).

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (b) weiter als Ausgangsstoffe zu verwendenden Thiophenderivate sind durch die Formel (V) allgemein definiert. In der Formel (V) haben Q, R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für Q, R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> angegeben wurden.

Die Ausgangsstoffe der Formel (V) sind bekannt und/oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden (vgl. EP 30142 / US-A-4481029 / US-A-4599103 / US-A-4701535, Herstellungsbeispiele).

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (c) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) als Ausgangsstoffe zu verwendenden substituierten Thiophenderivate sind durch die Formel (VI) allgemein definiert. In der Formel (VI) haben Q, R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für Q, R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> angegeben wurden; Z steht vorzugsweise für Fluor, Chlor, Brom, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder Phenoxy, insbesondere für Chlor, Methoxy, Ethoxy oder Phenoxy.

Die Ausgangsstoffe der Formel (VI) sind bekannt und/oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden.

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (d) zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) als Ausgangsstoffe zu verwendenden substituierten Amino-thiophene sind durch die Formel (VIII) allgemein definiert. In der allgemeinen Formel (VIII) haben  $R^4$  und  $R^5$  vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) vorzugsweise bzw. als insbesondere bevorzugt für  $R^4$  und  $R^5$  angegeben worden sind.

Die Ausgangsstoffe der allgemeinen Formel (VIII) sind bekannt und/oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden (vgl. Aust. J. Chem. 48 (1995), 1907-1916).

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (a), (b), (c) und (d) kommen vor allem inerte organische Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören insbesondere aliphatische, alicyclische oder aromatische, gegebenenfalls halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Benzin, Benzol, Toluol, Xylol, Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Petrolether, Hexan, Cyclohexan, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Dioxan, Tetrahydrofuran oder Ethylenglykoldimethyl- oder -diethylether; Ketone, wie Aceton, Butanon oder Methyl-isobutyl-keton; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril oder Benzonitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methyl-formanilid, N-Methyl-pyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester, sowie Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid.

Die erfindungsgemäßen Verfahren (a), (b), (c) und (d) werden vorzugsweise in Gegenwart eines geeigneten Reaktionshilfsmittels durchgeführt. Als solche kommen alle üblichen anorganischen oder organischen Basen infrage. Hierzu gehören bei-

spielsweise Erdalkali- oder Alkalimetall- -hydride, -hydroxide, -amide, -alkoholate, -acetate, -carbonate oder -hydrogencarbonate, wie beispielsweise Natriumhydrid, Natriumamid, Natriummethylat, Natriumethylat, Kalium-tert.-butylat, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Ammoniumhydroxid, Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, Ammoniumacetat, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat, Natriumhydrogencarbonat oder Ammoniumcarbonat sowie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

10

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (a), (b), (c) und (d) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen -20°C und +150°C, vorzugsweise zwischen -10°C und +120°C.

15

Die erfindungsgemäßen Verfahren (a), (b), (c) und (d) werden im allgemeinen unter Normaldruck durchgeführt. Es ist jedoch auch möglich, die erfindungsgemäßen Verfahren unter erhöhtem oder vermindertem Druck - im allgemeinen zwischen 0,1 bar und 10 bar - durchzuführen.

20

Zur Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (a), (b), (c) und (d) werden die Ausgangsstoffe im allgemeinen in angenähert äquimolaren Mengen eingesetzt. Es ist jedoch auch möglich, eine der Komponenten in einem größeren Überschuß zu verwenden. Die Umsetzung wird im allgemeinen in einem geeigneten Verdünnungsmittel in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels durchgeführt und das Reaktionsgemisch wird im allgemeinen mehrere Stunden bei der erforderlichen Temperatur gerührt. Die Aufarbeitung wird nach üblichen Methoden durchgeführt (vgl. die Herstellungsbeispiele).

30

Aus den erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) können gegebenenfalls Salze hergestellt werden. Man erhält solche Salze in einfacher Weise nach

üblichen Salzbildungsmethoden, beispielsweise durch Lösen oder Dispergieren einer Verbindung der Formel (I) in einem geeigneten Lösungsmittel, wie z.B. Methylenchlorid, Aceton, tert-Butyl-methylether oder Toluol, und Zugabe einer geeigneten Base. Die Salze können dann - gegebenenfalls nach längerem Rühren - durch Einengen oder Absaugen isoliert werden.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als Defolianten, Desiccants, Krautabtötungsmittel und insbesondere als Unkrautvernichtungsmittel verwendet werden. Unter Unkraut im weitesten Sinne sind alle Pflanzen zu verstehen, die an Orten aufwachsen, wo sie unerwünscht sind. Ob die erfindungsgemäßen Stoffe als totale oder selektive Herbizide wirken, hängt im wesentlichen von der angewendeten Menge ab.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können z.B. bei den folgenden Pflanzen verwendet werden:

Dikotyle Unkräuter der Gattungen: Abutilon, Amaranthus, Ambrosia, Anoda, Anthemis, Aphanes, Atriplex, Bellis, Bidens, Capsella, Carduus, Cassia, Centaurea, Chenopodium, Cirsium, Convolvulus, Datura, Desmodium, Emex, Erysimum, Euphorbia, Galeopsis, Galinsoga, Galium, Hibiscus, Ipomoea, Kochia, Lamium, Lepidium, Lindernia, Matricaria, Mentha, Mercurialis, Mullugo, Myosotis, Papaver, Pharbitis, Plantago, Polygonum, Portulaca, Ranunculus, Raphanus, Rorippa, Rotala, Rumex, Salsola, Senecio, Sesbania, Sida, Sinapis, Solanum, Sonchus, Sphenoclea, Stellaria, Taraxacum, Thlaspi, Trifolium, Urtica, Veronica, Viola, Xanthium.

Dikotyle Kulturen der Gattungen: Arachis, Beta, Brassica, Cucumis, Cucurbita, Helianthus, Daucus, Glycine, Gossypium, Ipomoea, Lactuca, Linum, Lycopersicon, Nicotiana, Phaseolus, Pisum, Solanum, Vicia.

Monokotyle Unkräuter der Gattungen: Aegilops, Agropyron, Agrostis, Alopecurus, Apera, Avena, Brachiaria, Bromus, Cenchrus, Commelina, Cynodon, Cyperus, Dactyloctenium, Digitaria, Echinochloa, Eleocharis, Eleusine, Eragrostis, Eriochloa,

Festuca, Fimbristylis, Heteranthera, Imperata, Ischaemum, Leptochloa, Lolium, Monochoria, Panicum, Paspalum, Phalaris, Phleum, Poa, Rottboellia, Sagittaria, Scirpus, Setaria, Sorghum.

- 5 Monokotyle Kulturen der Gattungen: Allium, Ananas, Asparagus, Avena, Hordeum, Oryza, Panicum, Saccharum, Secale, Sorghum, Triticale, Triticum, Zea.

Die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe ist jedoch keineswegs auf diese Gattungen beschränkt, sondern erstreckt sich in gleicher Weise auch auf andere  
10 Pflanzen.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich in Abhängigkeit von der Konzentration zur Totalunkrautbekämpfung, z.B. auf Industrie- und Gleisanlagen und auf Wegen und Plätzen mit und ohne Baumbewuchs. Ebenso können die erfindungsgemäßen Wirkstoffe zur Unkrautbekämpfung in Dauerkulturen, z.B. Forst, Zierge-  
15 hölz-, Obst-, Wein-, Citrus-, Nuß-, Bananen-, Kaffee-, Tee-, Gummi-, Ölpalm-, Kakao-, Beerenfrucht- und Hopfenanlagen, auf Zier- und Sportrasen und Weideflächen sowie zur selektiven Unkrautbekämpfung in einjährigen Kulturen eingesetzt werden.

20 Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) zeigen starke herbizide Wirksamkeit und ein breites Wirkungsspektrum bei Anwendung auf dem Boden und auf oberirdische Pflanzenteile. Sie eignen sich in gewissem Umfang auch zur selektiven Bekämpfung von monokotylen und dikotylen Unkräutern in monokotylen und di-  
25 kotylen Kulturen, sowohl im Vorauf- als auch im Nachauf-Verfahren.

Die Wirkstoffe können in die üblichen Formulierungen übergeführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Spritzpulver, Suspensionen, Pulver, Stäubemittel, Pasten, lösliche Pulver, Granulate, Suspensions-Emulsions-Konzentrate, Wirkstoff-im-  
30 prägnierte Natur- und synthetische Stoffe sowie Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen.

Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z. B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiernmitteln und/oder schaum erzeugenden Mitteln.

Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im wesentlichen in Frage: Aromaten, wie Xylol, Toluol, oder Alkyl-naphthaline, chlorierte Aromaten und chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfraktionen, mineralische und pflanzliche Öle, Alkohole, wie Butanol oder Glykol sowie deren Ether und Ester, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser.

Als feste Trägerstoffe kommen in Frage: z.B. Ammoniumsalze und natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate, als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnußschalen, Maiskolben und Tabakstengeln; als Emulgier- und/oder schaum erzeugende Mittel kommen in Frage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäure-Ester, Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, z.B. Alkylarylpolglykolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate; als Dispergiernmittel kommen in Frage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulvrige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kephaline und Lecithine und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyanin-farbstoffe und Spurennährstoffe wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten Herbiziden zur Unkrautbekämpfung Verwendung finden, wobei Fertigformulierungen oder Tankmischungen möglich sind.



Für die Mischungen kommen bekannte Herbizide infrage, beispielsweise

Acetochlor, Acifluorfen(-sodium), Aclonifen, Alachlor, Alloxydim(-sodium),  
Ametryne, Amidochlor, Amidosulfuron, Anilofos, Asulam, Atrazine, Azafenidin,  
5 Azimsulfuron, Benazolin(-ethyl), Benfuresate, Bensulfuron(-methyl), Bentazon,  
Benzobicyclon, Benzofenap, Benzoylprop(-ethyl), Bialaphos, Bifenox, Bispyribac(-  
sodium), Bromobutide, Bromofenoxim, Bromoxynil, Butachlor, Butroxydim,  
Butylate, Cafenstrole, Caloxydim, Carbetamide, Carfentrazone(-ethyl), Chlo-  
methoxyfen, Chloramben, Chloridazon, Chlorimuron(-ethyl), Chlornitrofen, Chlor-  
10 sulfuron, Chlortoluron, Cinidon(-ethyl), Cinmethylin, Cinosulfuron, Clefoxydim,  
Clethodim, Clodinafop(-propargyl), Clomazone, Clomeprop, Clopyralid, Clopyra-  
sulfuron(-methyl), Cloransulam(-methyl), Cumyluron, Cyanazine, Cybutryne,  
Cycloate, Cyclosulfamuron, Cycloxydim, Cyhalofop(-butyl), 2,4-D, 2,4-DB, 2,4-DP,  
Desmedipham, Diallate, Dicamba, Diclofop(-methyl), Diclosulam, Diethatyl(-ethyl),  
15 Difenzoquat, Diflufenican, Diflufenzopyr, Dimefuron, Dimepiperate, Dimethachlor,  
Dimethametryn, Dimethenamid, Dimexyflam, Dinitramine, Diphenamid, Diquat, Di-  
thiopyr, Diuron, Dymron, Epropodan, EPTC, Esprocarb, Ethalfluralin, Ethametsulf-  
uron(-methyl), Ethofumesate, Ethoxyfen, Ethoxysulfuron, Etobenzanid, Fenoxaprop-  
(-P-ethyl), Fentrazamide, Flamprop(-isopropyl), Flamprop(-isopropyl-L), Flamprop(-  
20 methyl), Flazasulfuron, Florasulam, Fluazifop(-P-butyl), Fluazolate, Flucarbazone,  
Flufenacet, Flumetsulam, Flumiclorac(-pentyl), Flumioxazin, Flumipropyn, Flumet-  
sulam, Fluometuron, Fluorochloridone, Fluoroglycofen(-ethyl), Flupoxam, Fluprop-  
acil, Flurpyrsulfuron(-methyl, -sodium), Flurenol(-butyl), Fluridone, Fluroxypyr(-  
meptyl), Flurprimidol, Flurtamone, Fluthiacet(-methyl), Fluthiamide, Fomesafen,  
25 Glufosinate(-ammonium), Glyphosate(-isopropylammonium), Halosafen, Haloxyfop-  
(-ethoxyethyl), Haloxyfop(-P-methyl), Hexazinone, Imazamethabenz(-methyl),  
Imazamethapyr, Imazamox, Imazapic, Imazapyr, Imazaquin, Imazethapyr, Imazo-  
sulfuron, Iodosulfuron(-methyl, -sodium), Ioxynil, Isopropalin, Isoproturon, Isouron,  
Isoxaben, Isoxachlortole, Isoxaflutole, Isoxapyrifop, Lactofen, Lenacil, Linuron,  
30 MCPA, MCPP, Mefenacet, Mesotrione, Metamitron, Metazachlor, Methabenzthiaz-  
uron, Metobenzuron, Metobromuron, (alpha-)Metolachlor, Metosulam, Metoxuron,

Metribuzin, Metsulfuron(-methyl), Molinate, Monolinuron, Naproanilide, Napropamide, Neburon, Nicosulfuron, Norflurazon, Orbencarb, Oryzalin, Oxadiargyl, Oxadiazon, Oxasulfuron, Oxaziclomefone, Oxyfluorfen, Paraquat, Pelargonsäure, Pendimethalin, Pendralin, Pentoxazone, Phenmedipham, Piperophos, Pretilachlor, Primsulfuron(-methyl), Prometryn, Propachlor, Propanil, Propaquizafop, Propisochlor, Propyzamide, Prosulfocarb, Prosulfuron, Pyraflufen(-ethyl), Pyrazolate, Pyrazosulfuron(-ethyl), Pyrazoxyfen, Pyribenzoxim, Pyributicarb, Pyridate, Pyriminobac(-methyl), Pyriothiobac(-sodium), Quinchlorac, Quinmerac, Quinoclamine, Quizalofop(-P-ethyl), Quizalofop(-P-tefuryl), Rimsulfuron, Sethoxydim, Simazine, Simetryn, Sulcotrione, Sulfentrazone, Sulfometuron(-methyl), Sulfosate, Sulfosulfuron, Tebutam, Tebuthiuron, Tepraloxydim, Terbutylazine, Terbutryn, Thenylchlor, Thiaflumide, Thiazopyr, Thidiazimin, Thifensulfuron(-methyl), Thiobencarb, Tiocarbazil, Tralkoxydim, Triallate, Triasulfuron, Tribenuron(-methyl), Triclopyr, Tridiphane, Trifluralin und Triflusulfuron.

15

Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Fungiziden, Insektiziden, Akariziden, Nematiziden, Schutzstoffen gegen Vogelfraß, Pflanzennährstoffen und Bodenstruktur-verbesserungsmitteln ist möglich.

20

Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus durch weiteres Verdünnen bereiteten Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige Lösungen, Suspensionen, Emulsionen, Pulver, Pasten und Granulate angewandt werden. Die Anwendung geschieht in üblicher Weise, z.B. durch Gießen, Spritzen, Sprühen, Streuen.

25

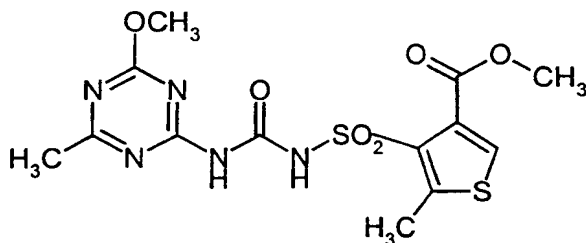
Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können sowohl vor als auch nach dem Auflaufen der Pflanzen appliziert werden. Sie können auch vor der Saat in den Boden eingearbeitet werden.

30

Die angewandte Wirkstoffmenge kann in einem größeren Bereich schwanken. Sie hängt im wesentlichen von der Art des gewünschten Effektes ab. Im allgemeinen

liegen die Aufwandmengen zwischen 1 g und 10 kg Wirkstoff pro Hektar Bodenfläche, vorzugsweise zwischen 5 g und 5 kg pro ha.

Die Herstellung und die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe geht aus  
5 den nachfolgenden Beispielen hervor.

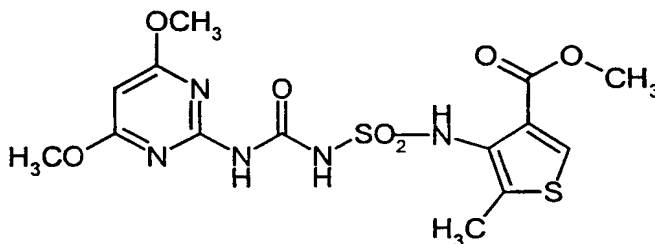
**Herstellungsbeispiele:****Beispiel 1**

5 (Verfahren (b))

0,75 g (2,9 mMol) 2-Phenoxycarbonylamino-4-methoxy-6-methyl-1,3,5-triazin  
werden in 40 ml Acetonitril gelöst und nacheinander mit 0,75 g (3,2 mMol) 2-  
Methyl-3-sulfamoyl-thiophen-4-carbonsäure-methylester und 0,49 g (3,2 mMol)  
10 Diazabicycloundecen (DBU) versetzt. Die Reaktionsmischung wird 12 Stunden bei  
Raumtemperatur (ca. 20°C) gerührt und anschließend im Wasserstrahlvakuum einge-  
engt. Der Rückstand wird in Methylenchlorid aufgenommen, mit 2N-Salzsäure und  
mit Wasser gewaschen, mit Magnesiumsulfat getrocknet und filtriert. Das Filtrat  
wird im Wasserstrahlvakuum eingeengt, der Rückstand mit Diethylether digeriert  
15 und das kristallin angefallene Produkt durch Absaugen isoliert.

Man erhält 0,60 g (52% der Theorie) N-(4-Methoxy-6-methyl-1,3,5-triazin-2-yl)-N'-  
(4-methoxycarbonyl-2-methyl-thien-3-yl-sulfonyl)-harnstoff vom Schmelzpunkt  
195°C.

20

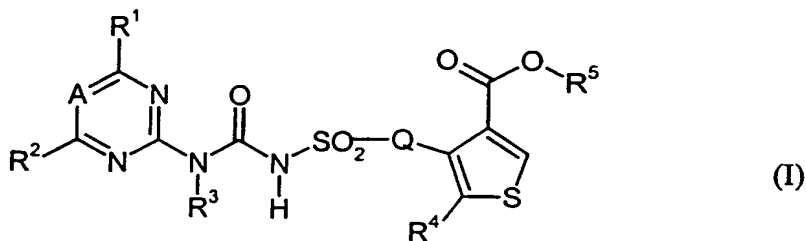
**Beispiel 2**

(Verfahren (d))

1,05 g (7,5 mMol) Chlorsulfonylisocyanat werden in 75 ml Methylenchlorid vorgelegt. Nach Abkühlen auf  $-10^{\circ}\text{C}$  wird zu dieser Mischung unter Rühren eine Lösung von 1,16 g (7,5 mMol) 2-Amino-4,6-dimethoxy-pyrimidin in 30 ml Methylenchlorid tropfenweise gegeben und die Mischung wird 30 Minuten bei  $-10^{\circ}\text{C}$  gerührt. Dann wird bei  $0^{\circ}\text{C}$  eine Lösung von 1,28 g (7,5 mMol) 3-Amino-2-methyl-thiophen-4-carbonsäure-methylester und 0,75 g (7,5 mMol) Triethylamin in 50 ml Methylenchlorid tropfenweise dazu gegeben und die Reaktionsmischung wird 12 Stunden bei Raumtemperatur (ca.  $20^{\circ}\text{C}$ ) gerührt. Anschließend werden 100 ml Wasser und 100 ml 2N-Salzsäure dazu gegeben, die organische Phase abgetrennt, mit 50 ml Wasser gewaschen, mit Magnesiumsulfat getrocknet und filtriert. Das Filtrat wird im Wasserstrahlvakuum eingeeengt und der Rückstand aus Ethanol kristallisiert.

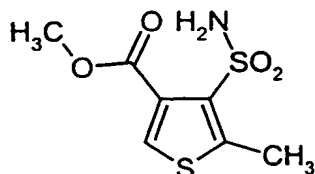
Man erhält 2,1 g (66% der Theorie) N-(4,6-Dimethoxy-pyrimidin-2-yl)-N'-(4-methoxycarbonyl-2-methyl-thien-3-yl-amino-sulfonyl)-harnstoff vom Schmelzpunkt  $174^{\circ}\text{C}$ .

Analog zu den Beispielen 1 und 2 sowie entsprechend der allgemeinen Beschreibung des erfindungsgemäßen Herstellungsverfahrens können beispielsweise auch die in der nachstehenden Tabelle 1 aufgeführten Verbindungen der allgemeinen Formel (I) hergestellt werden.

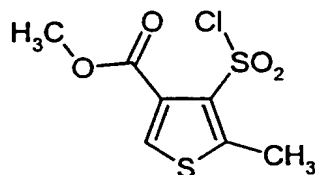


**Tabelle 1:** Beispiele für die Verbindungen der Formel (I)

| Bsp.-<br>Nr. | A  | Q  | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>   | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>                  | R <sup>5</sup>                | Schmelz-<br>punkt<br>(°C) |
|--------------|----|----|------------------|------------------|----------------|---------------------------------|-------------------------------|---------------------------|
| 3            | CH | NH | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | H              | n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 140                       |
| 4            | CH | NH | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | H              | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 154                       |
| 5            | CH | NH | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | H              | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | CH <sub>3</sub>               | 195                       |
| 6            | CH | -  | OCH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | H              | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>               | 194                       |

**Ausgangsstoffe der Formel (V):****Beispiel (V-1)**

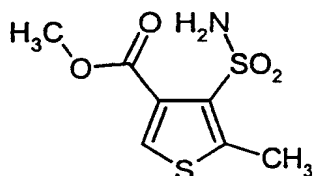
5

**Stufe 1**

- 10 Eine Lösung von 19,9 g (0,29 Mol) Natriumnitrit in 60 ml Wasser wird bei 0°C bis 5°C tropfenweise unter Rühren zu einer Lösung von 42,7 g (0,25 Mol) 3-Amino-2-methyl-thiophen-4-carbonsäure-methylester in 75 ml 10%iger wässriger Salzsäure gegeben. Die Reaktionsmischung wird 60 Minuten bei 0°C bis 5°C gerührt. Anschließend wird der Nitrit-Überschuß mit Amidosulfonsäure beseitigt. Die Mischung
- 15 wird dann bei 0°C bis 5°C tropfenweise unter Rühren zu einer Lösung von 35 g (0,55 Mol) Schwefeldioxid in 300 ml Methylenchlorid gegeben. Nach Zugabe von 1,5 g Kupfer(I)-chlorid und 1,5 g Dodecyl-trimethylammonium-bromid wird die Reaktionsmischung 60 Minuten bei 40°C und weiter 12 Stunden bei 20°C gerührt. Anschließend werden 18 ml 35%ige wässrige Salzsäure dazu gegeben, die Mischung
- 20 4 Stunden bei 20°C gerührt und dann die Phasen getrennt. Die wässrige Phase wird mit Methylenchlorid nachextrahiert, die vereinigten organischen Phasen mit Wasser gewaschen, mit Magnesiumsulfat getrocknet und filtriert. Das Filtrat wird im Wasserstrahlvakuum eingedunstet und der Rückstand aus Hexan kristallisiert.

Man erhält 51,7 g (81% der Theorie) 4-Methoxycarbonyl-2-methyl-thiophen-3-sulfonsäurechlorid.

Stufe 2



5

Eine Mischung aus 45 g (177 mMol) 4-Methoxycarbonyl-2-methyl-thiophen-3-sulfonsäurechlorid, 34 g (354 mMol) Ammoniumcarbonat und 400 ml Methylenchlorid wird 12 Stunden bei Raumtemperatur (ca. 20°C) gerührt. Nach Filtration wird vom Filtrat das Lösungsmittel im Wasserstrahlvakuum abdestilliert, der Rückstand mit Diethylether digeriert und das kristalline Produkt durch Absaugen isoliert.

10

Man erhält 21,5 g (52% der Theorie) 4-Methoxycarbonyl-2-methyl-thiophen-3-sulfonamid.

15



**Anwendungsbeispiele:****Beispiel A**

## 5      Pre-emergence-Test

Lösungsmittel:      5 Gewichtsteile Aceton

Emulgator:      1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

10      Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel, gibt die angegebene Menge Emulgator zu und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15      Samen der Testpflanzen werden in normalen Boden ausgesät. Nach ca. 24 Stunden wird der Boden so mit der Wirkstoffzubereitung besprüht, daß die jeweils gewünschte Wirkstoffmenge pro Flächeneinheit ausgebracht wird. Die Konzentration der Spritzbrühe wird so gewählt, daß in 1000 Liter Wasser pro Hektar die jeweils gewünschte Wirkstoffmenge ausgebracht wird.

20

Nach drei Wochen wird der Schädigungsgrad der Pflanzen bonitiert in % Schädigung im Vergleich zur Entwicklung der unbehandelten Kontrolle.

Es bedeuten:

25

0 %      =      keine Wirkung (wie unbehandelte Kontrolle)

100 %   =      totale Vernichtung

30      In diesem Test zeigen beispielsweise die Verbindungen gemäß Herstellungsbeispiel 1, 2, 3, 4, 5 und 6 bei teilweise guter Verträglichkeit gegenüber Kulturpflanzen, wie z.B. Baumwolle, Mais und Soja, sehr starke Wirkung gegen Unkräuter.

**Tabelle A1:** Pre emergence-Test/Gewächshaus

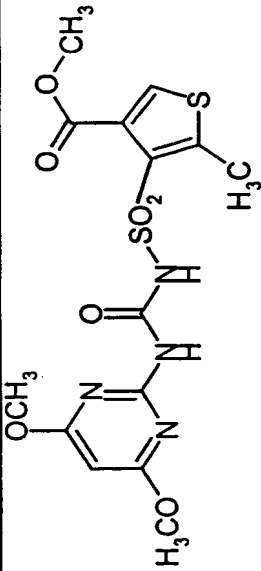
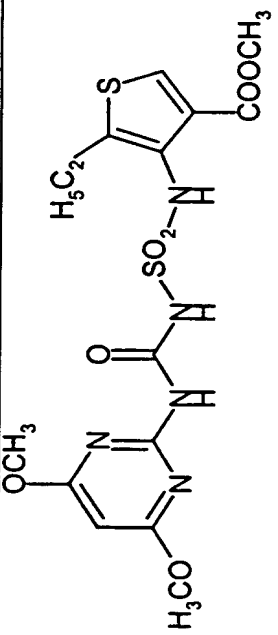
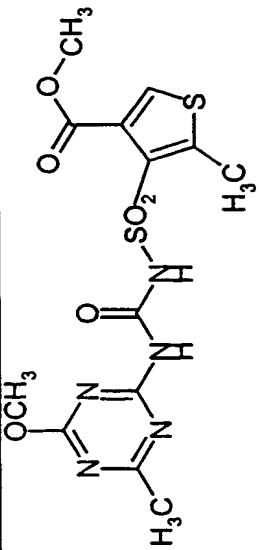
| Wirkstoff gemäß<br>Herstellungsbeispiel-Nr.   | Aufwand-<br>menge (g ai./ha) | Baum-<br>wolle | Alope-<br>curus | Ama-<br>ranthus | Stellaria | Viola |
|---|------------------------------|----------------|-----------------|-----------------|-----------|-------|
|  |                              |                |                 |                 |           |       |
| (6)   | 15                           | 0              | 80              | 90              | 90        | 100   |

Tabelle A2: Pre emergence-Test/Gewächshaus

| Wirkstoff gemäß<br>Herstellungsbeispiel-Nr.   | Aufwand-<br>menge (g ai./ha) | Mais | Cyperus | Cheno-<br>podium | Matri-<br>caria | Viola |
|---|------------------------------|------|---------|------------------|-----------------|-------|
|  |                              |      |         |                  |                 |       |
| (5)   | 125                          | 20   | 95      | 95               | 100             | 95    |

**Tabelle A3:** Pre emergence-Test/Gewächshaus

| Wirkstoff gemäß<br>Herstellungsbeispiel-Nr.  | Aufwand-<br>menge (g ai./ha) | Soja | Matri-<br>caria | Stellaria | Vero-<br>nica | Viola |
|--|------------------------------|------|-----------------|-----------|---------------|-------|
| <br>(1) | 4                            | 10   | 95              | 95        | 95            | 100   |

**Tabelle A4:** Pre emergence-Test/Gewächshaus

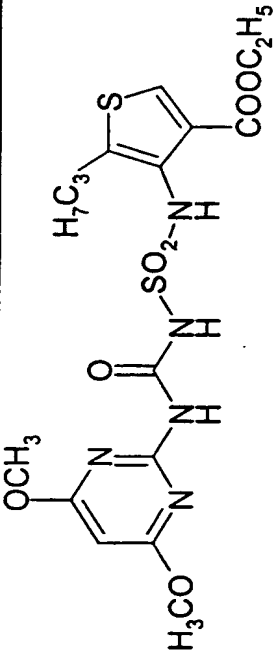
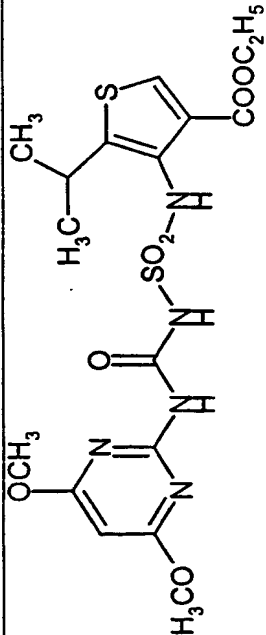
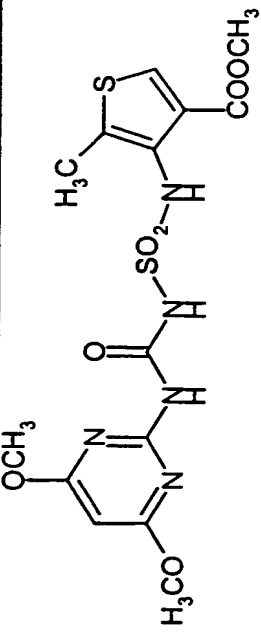
| Wirkstoff gemäß<br>Herstellungsbeispiel-Nr.   | Aufwand-<br>menge (g ai./ha) | Alope-<br>curus | Abutilon | Ama-<br>ranthus | Sinapis |
|---|------------------------------|-----------------|----------|-----------------|---------|
|  | 250                          | 70              | 80       | 90              | 90      |
| (3)   |                              |                 |          |                 |         |

Tabelle A5: Pre emergence-Test/Gewächshaus

| Wirkstoff gemäß<br>Herstellungsbeispiel-Nr.   | Aufwand-<br>menge (g ai./ha) | Alope-<br>curus | Cyperus | Abutilon | Ama-<br>ranthus | Sinapis |
|---|------------------------------|-----------------|---------|----------|-----------------|---------|
|  | 250                          | 100             | 90      | 95       | 90              | 90      |
| (4)   |                              |                 |         |          |                 |         |

**Tabelle A6:** Pre emergence-Test/Gewächshaus

| Wirkstoff gemäß<br>Herstellungsbeispiel-Nr.   | Aufwand-<br>menge (g ai./ha) | Mais | Cyperus | Abutilon | Ama-<br>ranthus | Sinapis |
|---|------------------------------|------|---------|----------|-----------------|---------|
|  | 250                          | 20   | 95      | 90       | 95              | 95      |
| (2)   |                              |      |         |          |                 |         |

**Beispiel B**

## Post-emergence-Test

- 5      Lösungsmittel:      5 Gewichtsteile Aceton  
Emulgator:              1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykoether

10      Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel, gibt die angegebene Menge Emulgator zu und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15      Mit der Wirkstoffzubereitung spritzt man Testpflanzen, welche eine Höhe von 5 - 15 cm haben so, daß die jeweils gewünschten Wirkstoffmengen pro Flächeneinheit ausgebracht werden. Die Konzentration der Spritzbrühe wird so gewählt, daß in 1000 l Wasser/ha die jeweils gewünschten Wirkstoffmengen ausgebracht werden.

20      Nach drei Wochen wird der Schädigungsgrad der Pflanzen bonitiert in % Schädigung im Vergleich zur Entwicklung der unbehandelten Kontrolle.

Es bedeuten:

0 %      =      keine Wirkung (wie unbehandelte Kontrolle)  
100 %    =      totale Vernichtung

25

In diesem Test zeigen beispielsweise die Verbindungen gemäß Herstellungsbeispiel 1, 2, 5 und 6 bei teilweise guter Verträglichkeit gegenüber Kulturpflanzen, wie z.B. Gerste und Weizen, sehr starke Wirkung gegen Unkräuter.



Tabelle B1: Post emergence-Test/Gewächshaus

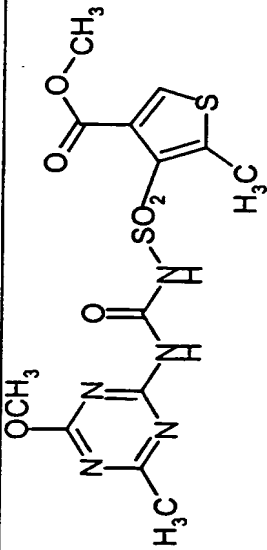
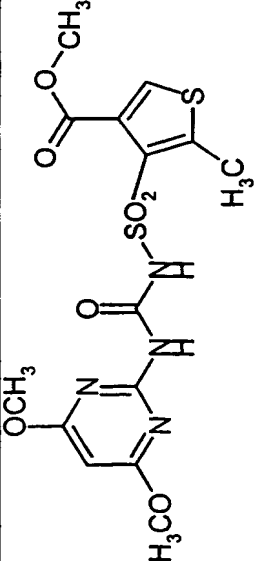
| Wirkstoff gemäß<br>Herstellungsbeispiel-Nr.   | Aufwand-<br>menge (g ai./ha) | Alope-<br>curus | Echino-<br>chloa | Lolium | Abu-<br>tilon | Stel-<br>laria | Vero-<br>nica | Viola |
|---|------------------------------|-----------------|------------------|--------|---------------|----------------|---------------|-------|
|  | 15                           | 100             | 100              | 100    | 100           | 100            | 100           | 100   |
| (1)   |                              |                 |                  |        |               |                |               |       |

Tabelle B2: Post emergence-Test/Gewächshaus

| Wirkstoff gemäß<br>Herstellungsbeispiel-Nr.   | Aufwand-<br>menge (g ai./ha) | Gerste | Alope-<br>curus | Abutilon | Ama-<br>ranthus | Stellaria |
|---|------------------------------|--------|-----------------|----------|-----------------|-----------|
|  |                              |        |                 |          |                 |           |
| (6)   | 4                            | 20     | 90              | 100      | 100             | 95        |

**Tabelle B3:** Post emergence-Test/Gewächshaus

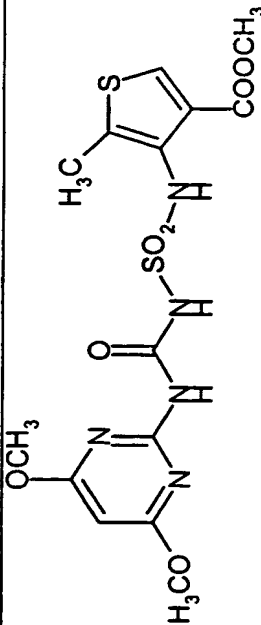
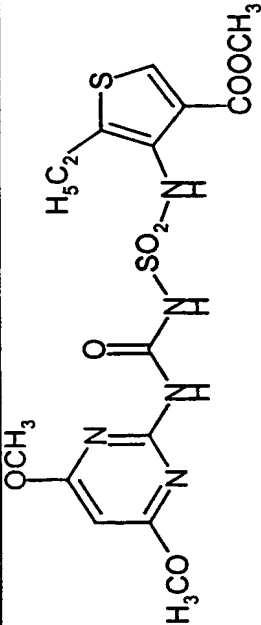
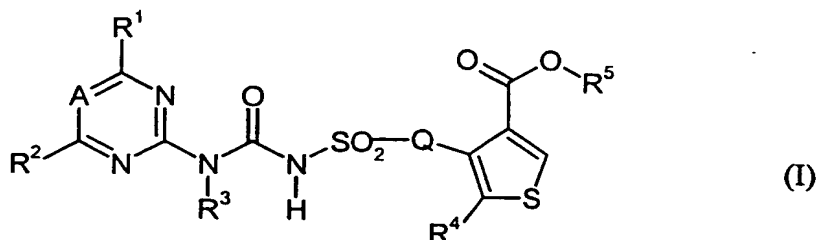
| Wirkstoff gemäß<br>Herstellungsbeispiel-Nr.   | Aufwand-<br>menge (g ai./ha) | Weizen | Ama-<br>ranthus | Matri-<br>caria | Viola | Xan-<br>thium |
|---|------------------------------|--------|-----------------|-----------------|-------|---------------|
|  | 125                          | 0      | 100             | 100             | 100   | 95            |
| (2)   |                              |        |                 |                 |       |               |

Tabelle B4: Post emergence-Test/Gewächshaus

| Wirkstoff gemäß<br>Herstellungsbeispiel-Nr.   | Aufwand-<br>menge (g ai./ha) | Weizen | Setaria | Cheno-<br>podium | Ipo-<br>moea | Matri-<br>caria |
|---|------------------------------|--------|---------|------------------|--------------|-----------------|
|  |                              |        |         |                  |              |                 |
| (5)   | 125                          | 20     | 90      | 100              | 100          | 100             |

**Patentansprüche**

## 1. Verbindungen der allgemeinen Formel (I)



5

in welcher

A für Stickstoff oder eine CH-Gruppierung steht,

10

Q für eine Einfachbindung oder für NH steht,

R<sup>1</sup> für Wasserstoff, Halogen oder jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylamino, Dialkylamino, Aryloxy oder Heterocyclyloxy steht,

15

R<sup>2</sup> für Wasserstoff, Halogen oder jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylamino, Dialkylamino, Aryloxy oder Heterocyclyloxy steht,

20

R<sup>3</sup> für Wasserstoff oder gegebenenfalls substituiertes Alkyl steht,

R<sup>4</sup> für Halogen oder gegebenenfalls substituiertes Alkyl steht und - für den Fall, daß Q für NH steht - auch für Wasserstoff steht, und

25

R<sup>5</sup> für Wasserstoff oder jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl oder Heterocyclyl steht,

sowie Salze von Verbindungen der Formel (I).

2. Verbindungen gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß

5

R<sup>1</sup> für Wasserstoff, für Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylamino oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy substituiertes Phenoxy, Oxetanyloxy, Furyloxy oder Tetrahydrofuryloxy steht,

10

R<sup>2</sup> für Wasserstoff, für Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylamino oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy substituiertes Phenoxy, Oxetanyloxy, Furyloxy oder Tetrahydrofuryloxy steht,

15

R<sup>3</sup> für Wasserstoff oder gegebenenfalls durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl-carbonyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl substituiertes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht,

20

R<sup>4</sup> für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen steht und - für den Fall, daß Q für NH steht - auch für Wasserstoff steht, und

25

R<sup>5</sup> für Wasserstoff, für gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkenyl oder Alkynyl mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen, für jeweils gegebenen-

30

5 falls durch Cyano, Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl substituiertes Cycloalkyl oder Cycloalkylalkyl mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Cycloalkylgruppen und gegebenenfalls 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy substituiertes Oxetanyl, Furyl oder Tetrahydrofuryl steht.

3. Verbindungen gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß

10 R<sup>1</sup> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino oder Diethylamino  
15 steht,

R<sup>2</sup> für Fluor, Chlor, Brom, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino oder Diethylamino steht,  
20

R<sup>3</sup> für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls durch Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Acetyl, Propionyl, n- oder i-Butyryl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl substituiertes Methyl oder Ethyl steht,  
25

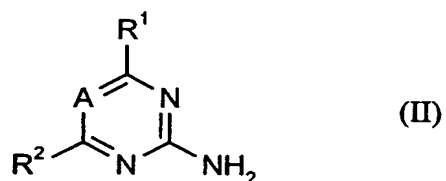
R<sup>4</sup> für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl steht, und  
30

- 5 R<sup>5</sup> für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Propenyl, Butenyl, Propinyl oder Butinyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl oder Cyclohexylmethyl steht.
- 10 4. Verbindungen gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß
- 15 R<sup>1</sup> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methylamino, Ethylamino, oder für Dimethylamino steht,
- 20 R<sup>2</sup> für Fluor, Chlor, Brom, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methylamino oder Ethylamino, oder für Dimethylamino steht,
- 25 R<sup>3</sup> für Wasserstoff oder Methyl steht,
- R<sup>4</sup> für jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl steht, und
- 30 R<sup>5</sup> für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes Propenyl oder Propinyl steht.



5. Natrium-, Kalium-, Magnesium-, Calcium-, Ammonium-, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl-ammonium-, Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)-ammonium-, Tri-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)-ammonium-, Tetra-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)-ammonium-, Tri-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)-sulfonium-, C<sub>5</sub>- oder C<sub>6</sub>-Cycloalkyl-ammonium- und Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-alkyl)-benzyl-ammonium-Salze von Verbindungen gemäß einem der Ansprüche 1 bis 4.
6. Verfahren zum Herstellen von Verbindungen gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5, dadurch gekennzeichnet, daß

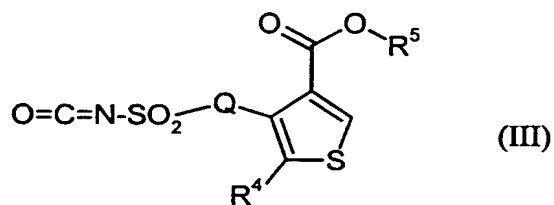
(a) Aminoazine der allgemeinen Formel (II)



in welcher

A, R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> in die einem der Ansprüche 1 bis 4 angegebene Bedeutung haben,

mit Thienyl(amino)sulfonylisocyanaten der allgemeinen Formel (III)



in welcher

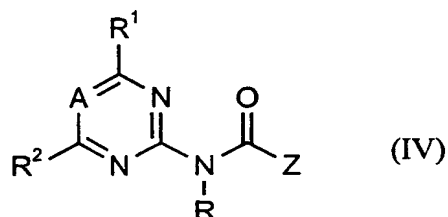
Q, R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> die in einem der Ansprüche 1 bis 4 angegebene Bedeutung haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt werden,

oder daß

5

(b) substituierte Aminoazine der allgemeinen Formel (IV)



in welcher

10

A, R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> die in einem der Ansprüche 1 bis 4 angegebene Bedeutung haben,

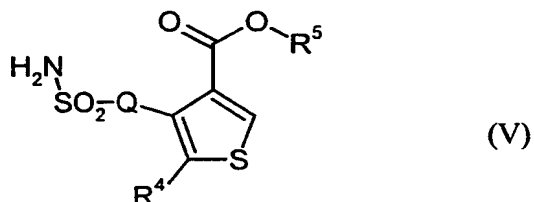
Z für Halogen, Alkoxy oder Aryloxy steht und

15

R die in einem der Ansprüche 1 bis 4 für R<sup>3</sup> angegebene Bedeutung hat oder für die Gruppierung -C(O)-Z steht,

mit Thiophenderivaten der allgemeinen Formel (V)

20



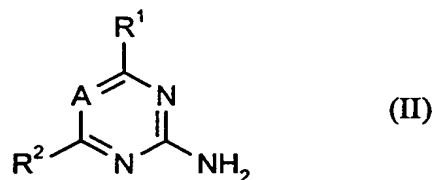
in welcher

Q, R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> die in einem der Ansprüche 1 bis 4 angegebene Bedeutung haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und gegebenenfalls  
in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt werden,

oder daß

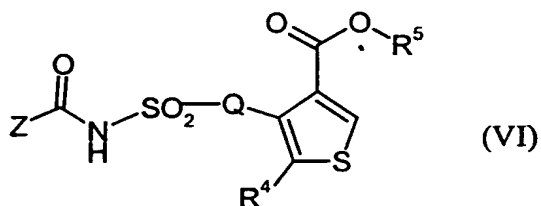
(c) Aminoazine der allgemeinen Formel (II)



in welcher

A, R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> die in einem der Ansprüche 1 bis 4 angegebene Bedeutung haben,

mit Thiophenderivaten der allgemeinen Formel (VI)



in welcher

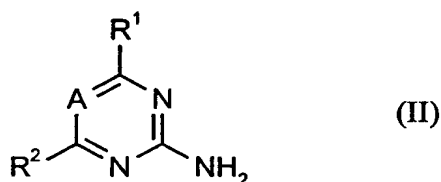
Q, R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> die in einem der Ansprüche 1 bis 4 angegebene Bedeutung haben und

Z für Halogen, Alkoxy oder Aryloxy steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt werden,

5 oder daß

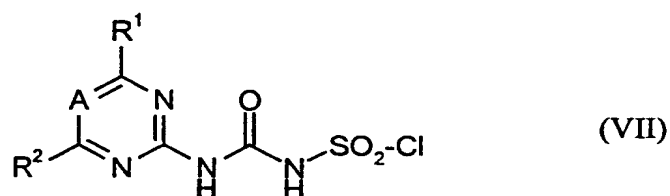
(d) Aminoazine der allgemeinen Formel (II)



10 in welcher

A, R¹ und R² die in einem der Ansprüche 1 bis 4 angegebene Bedeutung haben,

15 mit Chlorsulfonylisocyanat gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt werden und die hierbei gebildeten Chlorsulfonylamino-carbonylamino-azine der allgemeinen Formel (VII)

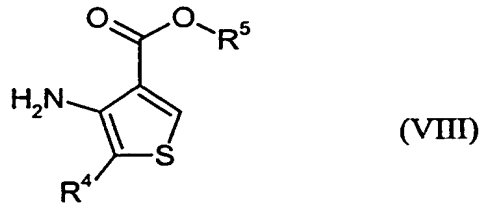


20 in welcher

A, R¹ und R² die in einem der Ansprüche 1 bis 4 angegebene Bedeutung haben,

25 - nach Zwischenisolierung oder „in situ“ -

mit substituierten Aminothiophenen der allgemeinen Formel (VIII)



5 in welcher

R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> die in einem der Ansprüche 1 bis 4 angegebene Bedeutung haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und gegebenenfalls  
10 in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt werden,

und gegebenenfalls die nach den Verfahren (a), (b), (c) oder (d) erhaltenen  
Verbindungen der Formel (I) nach üblichen Methoden in Salze überführt  
werden.

15

7. Verfahren zum Bekämpfen von unerwünschtem Pflanzenwuchs, dadurch gekennzeichnet, daß man mindestens eine Verbindung gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5 auf unerwünschte Pflanzen und/oder ihren Lebensraum einwirken läßt.

20

8. Verwendung von mindestens einer Verbindung gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5 zum Bekämpfen von unerwünschten Pflanzen.

25

9. Herbizides Mittel, gekennzeichnet durch einen Gehalt an einer Verbindung gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5 und üblichen Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Mitteln.

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES  
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
15. Februar 2001 (15.02.2001)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
**WO 01/10863 A3**

(51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>: C07D 409/12, A01N 43/66, 43/54

(74) Gemeinsamer Vertreter: BAYER AKTIENGESSELLSCHAFT; D-51368 Leverkusen (DE).

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP00/07096

(22) Internationales Anmeldedatum:  
25. Juli 2000 (25.07.2000)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:  
199 37 118.0 6. August 1999 (06.08.1999) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): BAYER AKTIENGESSELLSCHAFT [DE/DE]; D-51368 Leverkusen (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): GESING, Ernst, Rudolf, F. [DE/DE]; Trillser Graben 4, D-40699 Erkrath-Hochdahl (DE). KLUTH, Joachim [DE/DE]; Virneburgstrasse 69, D-40764 Langenfeld (DE). MÜLLER, Klaus-Helmut [AT/DE]; Solfstrasse 19, D-40593 Düsseldorf (DE). DREWES, Mark, Wilhelm [DE/DE]; Goethestrasse 38, D-40764 Langenfeld (DE). DAHMEN, Peter [DE/DE]; Altebrückerstrasse 63, D-41470 Neuss (DE). FEUCHT, Dieter [DE/DE]; Ackerweg 9, D-40789 Monheim (DE). PONTZEN, Rolf [DE/DE]; Am Kloster 69, D-42799 Leichlingen (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (national): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (regional): ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:

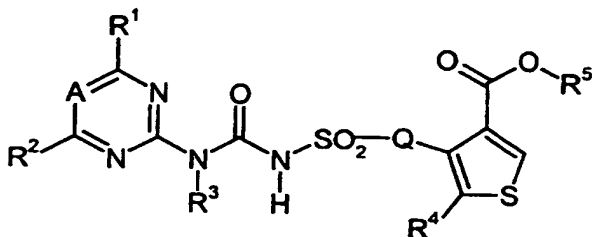
— mit internationalem Recherchenbericht

(88) Veröffentlichungsdatum des internationalen  
Recherchenberichts: 7. September 2001

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes, und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

(54) Title: SUBSTITUTED THIENYL(AMINO)SULFONYLUREAS

(54) Bezeichnung: SUBSTITUIERTE THIENYL(AMINO)SULFONYLHARNSTOFFE



(I)

(57) Abstract: The invention relates to thienyl(amino)sulfonylureas of formula (I), wherein A, Q, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> and R<sup>5</sup> have the meaning given in the description, and to a method for the preparation of said compounds and their use as herbicides.

(57) Zusammenfassung: Die Erfindung betrifft neue substituierte Thienyl(amino)sulfonylharnstoffe der allgemeinen Formel (I), in welcher A, Q, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> die in der Beschreibung angegebene Bedeutung haben, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Herbizide.

WO 01/10863 A3

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**



# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Inter Application No

PCT/EP 00/07096

## A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 7 C07D409/12 A01N43/66 A01N43/54

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 C07D A01N

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

CHEM ABS Data, WPI Data, EPO-Internal

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

| Category * | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages  | Relevant to claim No. |
|------------|---|-----------------------|
| X          | EP 0 030 142 A (DU PONT)<br>10 June 1981 (1981-06-10)<br>cited in the application<br>page 121 -page 126; table VIII<br>page 82 -page 86; table II<br>abstract; claim 1  | 1,7-9                 |
| X          | US 4 481 029 A (LEVITT GEORGE)<br>6 November 1984 (1984-11-06)<br>cited in the application<br>column 41 -column 42; table IA<br>abstract; claims 1,78,79<br>column 45 -column 46; table IA<br>column 179; table A | 1,7-9                 |
|            | -/--  |                       |

☒ Further documents are listed in the continuation of box C.

☒ Patent family members are listed in annex.

### \* Special categories of cited documents:

- \*A\* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- \*E\* earlier document but published on or after the international filing date
- \*L\* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- \*O\* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- \*P\* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- \*T\* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- \*X\* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- \*Y\* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- \*Z\* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

2 February 2001

Date of mailing of the international search report

12/02/2001

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Paisdor, B

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No.

PCT/EP 00/07096

## C. (Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

| Category * | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages   | Relevant to claim No. |
|------------|--|-----------------------|
| X          | <p>EP 0 097 122 A (CIBA GEIGY AG)<br/> 28 December 1983 (1983-12-28)<br/> cited in the application<br/> abstract<br/> page 23 -page 30; table 2<br/> -----</p> | 1, 7-9                |

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

on patent family members

International Application No

PCT/EP 00/07096

| Patent document<br>cited in search report |   | Publication<br>date | Patent family<br>member(s) | Publication<br>date |
|---|---|---------------------|----------------------------|---------------------|
| EP 0030142                                | A | 10-06-1981          | AT 10569 T                 | 15-12-1984          |
|   |   |                     | AU 536122 B                | 19-04-1984          |
|   |   |                     | AU 6476380 A               | 04-06-1981          |
|   |   |                     | BR 8007674 A               | 09-06-1981          |
|   |   |                     | CA 1189072 A               | 18-06-1985          |
|   |   |                     | CS 250207 B                | 16-04-1987          |
|   |   |                     | DE 3069777 D               | 17-01-1985          |
|   |   |                     | DK 471680 A                | 31-05-1981          |
|   |   |                     | ES 497298 D                | 16-06-1982          |
|   |   |                     | ES 8205764 A               | 01-11-1982          |
|   |   |                     | GB 2065116 A,B             | 24-06-1981          |
|   |   |                     | GR 72259 A                 | 07-10-1983          |
|   |   |                     | HU 193629 B                | 30-11-1987          |
|   |   |                     | IE 50745 B                 | 09-07-1986          |
|   |   |                     | IL 61578 A                 | 31-08-1987          |
|   |   |                     | JP 1028033 B               | 31-05-1989          |
|   |   |                     | JP 1543737 C               | 15-02-1990          |
|   |   |                     | JP 56103179 A              | 18-08-1981          |
|   |   |                     | KR 8500678 B               | 10-05-1985          |
|   |   |                     | LT 2556 R                  | 28-02-1994          |
|   |   |                     | LV 5574 A                  | 10-05-1994          |
|   |   |                     | NZ 195680 A                | 30-09-1983          |
|   |   |                     | PH 18851 A                 | 21-10-1985          |
|   |   |                     | PL 228148 A                | 07-08-1981          |
|   |   |                     | PT 72132 A,B               | 01-12-1980          |
|   |   |                     | RO 81268 A                 | 28-02-1985          |
|   |   |                     | SU 1748629 A               | 15-07-1992          |
|   |   |                     | TR 21804 A                 | 19-07-1985          |
|   |   |                     | US 4481029 A               | 06-11-1984          |
|   |   |                     | US 4599103 A               | 08-07-1986          |
|   |   |                     | US 4701535 A               | 20-10-1987          |
|   |   |                     | YU 302580 A                | 28-02-1983          |
|   |   |                     | ZA 8007458 A               | 28-07-1982          |
| US 4481029                                | A | 06-11-1984          | AT 10569 T                 | 15-12-1984          |
|   |   |                     | AU 536122 B                | 19-04-1984          |
|   |   |                     | AU 6476380 A               | 04-06-1981          |
|   |   |                     | BR 8007674 A               | 09-06-1981          |
|   |   |                     | CA 1189072 A               | 18-06-1985          |
|   |   |                     | CS 250207 B                | 16-04-1987          |
|   |   |                     | DE 3069777 D               | 17-01-1985          |
|   |   |                     | DK 471680 A                | 31-05-1981          |
|   |   |                     | EP 0030142 A               | 10-06-1981          |
|   |   |                     | ES 497298 D                | 16-06-1982          |
|   |   |                     | ES 8205764 A               | 01-11-1982          |
|   |   |                     | GB 2065116 A,B             | 24-06-1981          |
|   |   |                     | GR 72259 A                 | 07-10-1983          |
|   |   |                     | HU 193629 B                | 30-11-1987          |
|   |   |                     | IE 50745 B                 | 09-07-1986          |
|   |   |                     | IL 61578 A                 | 31-08-1987          |
|   |   |                     | JP 1028033 B               | 31-05-1989          |
|   |   |                     | JP 1543737 C               | 15-02-1990          |
|   |   |                     | JP 56103179 A              | 18-08-1981          |
|   |   |                     | KR 8500678 B               | 10-05-1985          |
|   |   |                     | LT 2556 R                  | 28-02-1994          |
|   |   |                     | LV 5574 A                  | 10-05-1994          |
|   |   |                     | NZ 195680 A                | 30-09-1983          |
|   |   |                     | PH 18851 A                 | 21-10-1985          |

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 00/07096

| Patent document<br>cited in search report | Publication<br>date | Patent family<br>member(s) | Publication<br>date |
|---|---------------------|----------------------------|---------------------|
| US 4481029 A                              |                     | PL 228148 A                | 07-08-1981          |
|   |                     | PT 72132 A, B              | 01-12-1980          |
|   |                     | RO 81268 A                 | 28-02-1985          |
|   |                     | SU 1748629 A               | 15-07-1992          |
|   |                     | TR 21804 A                 | 19-07-1985          |
|   |                     | US 4599103 A               | 08-07-1986          |
|   |                     | US 4701535 A               | 20-10-1987          |
|   |                     | YU 302580 A                | 28-02-1983          |
|   |                     | ZA 8007458 A               | 28-07-1982          |
| EP 0097122 A                              | 28-12-1983          | AT 43592 T                 | 15-06-1989          |
|   |                     | AU 565870 B                | 01-10-1987          |
|   |                     | AU 1570583 A               | 22-12-1983          |
|   |                     | BR 8303135 A               | 31-01-1984          |
|   |                     | CA 1185975 A               | 23-04-1985          |
|   |                     | CS 8500413 A               | 17-09-1985          |
|   |                     | CS 8304301 A               | 17-09-1985          |
|   |                     | DD 211057 A                | 04-07-1984          |
|   |                     | DE 3379949 D               | 06-07-1989          |
|   |                     | DK 270083 A                | 15-12-1983          |
|   |                     | EG 16281 A                 | 30-01-1989          |
|   |                     | ES 523183 D                | 01-03-1985          |
|   |                     | ES 8503342 A               | 01-06-1985          |
|   |                     | GR 78615 A                 | 27-09-1984          |
|   |                     | HU 192145 B                | 28-05-1987          |
|   |                     | JP 59005181 A              | 12-01-1984          |
|   |                     | MX 155115 A                | 29-01-1988          |
|   |                     | NZ 204548 A                | 08-08-1986          |
|   |                     | PH 19956 A                 | 14-08-1986          |
|   |                     | TR 21777 A                 | 03-07-1985          |
|   |                     | US 4549898 A               | 29-10-1985          |
|   |                     | ZA 8304305 A               | 28-03-1984          |
|   |                     | ZW 13283 A                 | 04-01-1984          |

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Inter. Aktenzeichen

PCT/EP 00/07096

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES  
IPK 7 C07D409/12 A01N43/66 A01N43/54

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

## B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)  
IPK 7 C07D A01N

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)  
CHEM ABS Data, WPI Data, EPO-Internal

## C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

| Kategorie* | Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile   | Betr. Anspruch Nr. |
|------------|--|--------------------|
| X          | EP 0 030 142 A (DU PONT)<br>10. Juni 1981 (1981-06-10)<br>in der Anmeldung erwähnt<br>Seite 121 -Seite 126; Tabelle VIII<br>Seite 82 -Seite 86; Tabelle II<br>Zusammenfassung; Anspruch 1  | 1,7-9              |
| X          | US 4 481 029 A (LEVITT GEORGE)<br>6. November 1984 (1984-11-06)<br>in der Anmeldung erwähnt<br>Spalte 41 -Spalte 42; Tabelle IA<br>Zusammenfassung; Ansprüche 1,78,79<br>Spalte 45 -Spalte 46; Tabelle IA<br>Spalte 179; Tabelle A | 1,7-9              |
|            | ---  |                    |
|            | --- --   |                    |

☒ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

☒ Siehe Anhang Patentfamilie

\* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

\*A\* Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

\*E\* älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

\*L\* Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

\*O\* Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

\*P\* Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

\*T\* Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

\*X\* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

\*Y\* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

\*Z\* Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

2. Februar 2001

Absenddatum des internationalen Recherchenberichts

12/02/2001

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde  
Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl.  
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Paisdor, B

## C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

| Kategorie* | Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile  | Betr. Anspruch Nr. |
|------------|---|--------------------|
| X          | EP 0 097 122 A (CIBA GEIGY AG)<br>28. Dezember 1983 (1983-12-28)<br>in der Anmeldung erwähnt<br>Zusammenfassung<br>Seite 23 -Seite 30; Tabelle 2<br>----- | 1,7-9              |

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichung ... die ... Patentfamilie gehören

Inter: ... des Aktenzeichen

PCT/EP 00/07096

| Im Recherchenbericht<br>angeführtes Patentdokument | Datum der<br>Veröffentlichung | Mitglied(er) der<br>Patentfamilie | Datum der<br>Veröffentlichung |
|--|-------------------------------|-----------------------------------|-------------------------------|
| EP 0030142 A                                       | 10-06-1981                    | AT 10569 T                        | 15-12-1984                    |
|  |                               | AU 536122 B                       | 19-04-1984                    |
|  |                               | AU 6476380 A                      | 04-06-1981                    |
|  |                               | BR 8007674 A                      | 09-06-1981                    |
|  |                               | CA 1189072 A                      | 18-06-1985                    |
|  |                               | CS 250207 B                       | 16-04-1987                    |
|  |                               | DE 3069777 D                      | 17-01-1985                    |
|  |                               | DK 471680 A                       | 31-05-1981                    |
|  |                               | ES 497298 D                       | 16-06-1982                    |
|  |                               | ES 8205764 A                      | 01-11-1982                    |
|  |                               | GB 2065116 A,B                    | 24-06-1981                    |
|  |                               | GR 72259 A                        | 07-10-1983                    |
|  |                               | HU 193629 B                       | 30-11-1987                    |
|  |                               | IE 50745 B                        | 09-07-1986                    |
|  |                               | IL 61578 A                        | 31-08-1987                    |
|  |                               | JP 1028033 B                      | 31-05-1989                    |
|  |                               | JP 1543737 C                      | 15-02-1990                    |
|  |                               | JP 56103179 A                     | 18-08-1981                    |
|  |                               | KR 8500678 B                      | 10-05-1985                    |
|  |                               | LT 2556 R                         | 28-02-1994                    |
|  |                               | LV 5574 A                         | 10-05-1994                    |
|  |                               | NZ 195680 A                       | 30-09-1983                    |
|  |                               | PH 18851 A                        | 21-10-1985                    |
|  |                               | PL 228148 A                       | 07-08-1981                    |
|  |                               | PT 72132 A,B                      | 01-12-1980                    |
|  |                               | RO 81268 A                        | 28-02-1985                    |
|  |                               | SU 1748629 A                      | 15-07-1992                    |
|  |                               | TR 21804 A                        | 19-07-1985                    |
|  |                               | US 4481029 A                      | 06-11-1984                    |
|  |                               | US 4599103 A                      | 08-07-1986                    |
|  |                               | US 4701535 A                      | 20-10-1987                    |
|  |                               | YU 302580 A                       | 28-02-1983                    |
|  |                               | ZA 8007458 A                      | 28-07-1982                    |
| US 4481029 A                                       | 06-11-1984                    | AT 10569 T                        | 15-12-1984                    |
|  |                               | AU 536122 B                       | 19-04-1984                    |
|  |                               | AU 6476380 A                      | 04-06-1981                    |
|  |                               | BR 8007674 A                      | 09-06-1981                    |
|  |                               | CA 1189072 A                      | 18-06-1985                    |
|  |                               | CS 250207 B                       | 16-04-1987                    |
|  |                               | DE 3069777 D                      | 17-01-1985                    |
|  |                               | DK 471680 A                       | 31-05-1981                    |
|  |                               | EP 0030142 A                      | 10-06-1981                    |
|  |                               | ES 497298 D                       | 16-06-1982                    |
|  |                               | ES 8205764 A                      | 01-11-1982                    |
|  |                               | GB 2065116 A,B                    | 24-06-1981                    |
|  |                               | GR 72259 A                        | 07-10-1983                    |
|  |                               | HU 193629 B                       | 30-11-1987                    |
|  |                               | IE 50745 B                        | 09-07-1986                    |
|  |                               | IL 61578 A                        | 31-08-1987                    |
|  |                               | JP 1028033 B                      | 31-05-1989                    |
|  |                               | JP 1543737 C                      | 15-02-1990                    |
|  |                               | JP 56103179 A                     | 18-08-1981                    |
|  |                               | KR 8500678 B                      | 10-05-1985                    |
|  |                               | LT 2556 R                         | 28-02-1994                    |
|  |                               | LV 5574 A                         | 10-05-1994                    |
|  |                               | NZ 195680 A                       | 30-09-1983                    |
|  |                               | PH 18851 A                        | 21-10-1985                    |

# INTERNATIONALE RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 00/07096

| Im Recherchenbericht<br>angeführtes Patentdokument | Datum der<br>Veröffentlichung | Mitglied(er) der<br>Patentfamilie | Datum der<br>Veröffentlichung |
|--|-------------------------------|-----------------------------------|-------------------------------|
| US 4481029 A                                       |                               | PL 228148 A                       | 07-08-1981                    |
|  |                               | PT 72132 A, B                     | 01-12-1980                    |
|  |                               | RO 81268 A                        | 28-02-1985                    |
|  |                               | SU 1748629 A                      | 15-07-1992                    |
|  |                               | TR 21804 A                        | 19-07-1985                    |
|  |                               | US 4599103 A                      | 08-07-1986                    |
|  |                               | US 4701535 A                      | 20-10-1987                    |
|  |                               | YU 302580 A                       | 28-02-1983                    |
|  |                               | ZA 8007458 A                      | 28-07-1982                    |
| EP 0097122 A                                       | 28-12-1983                    | AT 43592 T                        | 15-06-1989                    |
|  |                               | AU 565870 B                       | 01-10-1987                    |
|  |                               | AU 1570583 A                      | 22-12-1983                    |
|  |                               | BR 8303135 A                      | 31-01-1984                    |
|  |                               | CA 1185975 A                      | 23-04-1985                    |
|  |                               | CS 8500413 A                      | 17-09-1985                    |
|  |                               | CS 8304301 A                      | 17-09-1985                    |
|  |                               | DD 211057 A                       | 04-07-1984                    |
|  |                               | DE 3379949 D                      | 06-07-1989                    |
|  |                               | DK 270083 A                       | 15-12-1983                    |
|  |                               | EG 16281 A                        | 30-01-1989                    |
|  |                               | ES 523183 D                       | 01-03-1985                    |
|  |                               | ES 8503342 A                      | 01-06-1985                    |
|  |                               | GR 78615 A                        | 27-09-1984                    |
|  |                               | HU 192145 B                       | 28-05-1987                    |
|  |                               | JP 59005181 A                     | 12-01-1984                    |
|  |                               | MX 155115 A                       | 29-01-1988                    |
|  |                               | NZ 204548 A                       | 08-08-1986                    |
|  |                               | PH 19956 A                        | 14-08-1986                    |
|  |                               | TR 21777 A                        | 03-07-1985                    |
|  |                               | US 4549898 A                      | 29-10-1985                    |
|  |                               | ZA 8304305 A                      | 28-03-1984                    |
|  |                               | ZW 13283 A                        | 04-01-1984                    |



PCT

## NOTIFICATION OF ELECTION

(PCT Rule 61.2)

From the INTERNATIONAL BUREAU

To:

Commissioner  
US Department of Commerce  
United States Patent and Trademark  
Office, PCT  
2011 South Clark Place Room  
CP2/5C24  
Arlington, VA 22202  
ETATS-UNIS D'AMERIQUE

in its capacity as elected Office

|   |   |
|---|---|
| Date of mailing:<br>15 February 2001 (15.02.01)       |   |
| International application No.:<br>PCT/EP00/07096      | Applicant's or agent's file reference:<br>LEA33917-WO |
| International filing date:<br>25 July 2000 (25.07.00) | Priority date:<br>06 August 1999 (06.08.99)           |
| Applicant:<br>GESING, Ernst, Rudolf, F. et al         |   |

1. The designated Office is hereby notified of its election made:

☒ in the demand filed with the International preliminary Examining Authority on:  
20 December 2000 (20.12.00)

☐ in a notice effecting later election filed with the International Bureau on:  
\_\_\_\_\_

2. The election ☒ was

☐ was not

made before the expiration of 19 months from the priority date or, where Rule 32 applies, within the time limit under Rule 32.2(b).

|   |   |
|---|---|
| The International Bureau of WIPO<br>34, chemin des Colombettes<br>1211 Geneva 20, Switzerland<br>Facsimile No.: (41-22) 740.14.35 | Authorized officer:<br><br>J. Zahra<br>Telephone No.: (41-22) 338.83.38 |
|---|---|

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**

# VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

## PCT

### INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

(Artikel 18 sowie Regeln 43 und 44 PCT)

|   |   |   |
|---|---|---|
| Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts<br><b>LEA33917-WO</b> | <b>WEITERES VORGEHEN</b><br>siehe Mitteilung über die Übermittlung des internationalen Recherchenberichts (Formblatt PCT/ISA/220) sowie, soweit zutreffend, nachstehender Punkt 5 |   |
| Internationales Aktenzeichen<br><b>PCT/EP 00/07096</b>        | Internationales Anmeldedatum<br>(Tag/Monat/Jahr)<br><b>25/07/2000</b>   | (Frühestes) Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr)<br><b>06/08/1999</b> |
| Anmelder<br><br><b>BAYER AKTIENGESELLSCHAFT</b>               |   |   |

Dieser internationale Recherchenbericht wurde von der Internationalen Recherchenbehörde erstellt und wird dem Anmelder gemäß Artikel 18 übermittelt. Eine Kopie wird dem Internationalen Büro übermittelt.

Dieser internationale Recherchenbericht umfaßt insgesamt 3 Blätter.

☒ Darüber hinaus liegt ihm jeweils eine Kopie der in diesem Bericht genannten Unterlagen zum Stand der Technik bei.

#### 1. Grundlage des Berichts

a. Hinsichtlich der **Sprache** ist die internationale Recherche auf der Grundlage der internationalen Anmeldung in der Sprache durchgeführt worden, in der sie eingereicht wurde, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.

☐ Die internationale Recherche ist auf der Grundlage einer bei der Behörde eingereichten Übersetzung der internationalen Anmeldung (Regel 23.1 b)) durchgeführt worden.

b. Hinsichtlich der in der internationalen Anmeldung offenbarten **Nucleotid- und/oder Aminosäuresequenz** ist die internationale Recherche auf der Grundlage des Sequenzprotokolls durchgeführt worden, das

☐ in der internationalen Anmeldung in schriftlicher Form enthalten ist.

☐ zusammen mit der internationalen Anmeldung in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.

☐ bei der Behörde nachträglich in schriftlicher Form eingereicht worden ist.

☐ bei der Behörde nachträglich in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.

☐ Die Erklärung, daß das nachträglich eingereichte schriftliche Sequenzprotokoll nicht über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung im Anmeldezeitpunkt hinausgeht, wurde vorgelegt.

☐ Die Erklärung, daß die in computerlesbarer Form erfaßten Informationen dem schriftlichen Sequenzprotokoll entsprechen, wurde vorgelegt.

2. ☐ Bestimmte Ansprüche haben sich als nicht recherchierbar erwiesen (siehe Feld I).

3. ☐ Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung (siehe Feld II).

#### 4. Hinsichtlich der Bezeichnung der Erfindung

☒ wird der vom Anmelder eingereichte Wortlaut genehmigt.

☐ wurde der Wortlaut von der Behörde wie folgt festgesetzt:

#### 5. Hinsichtlich der Zusammenfassung

☒ wird der vom Anmelder eingereichte Wortlaut genehmigt.

☐ wurde der Wortlaut nach Regel 38.2b) in der in Feld III angegebenen Fassung von der Behörde festgesetzt. Der Anmelder kann der Behörde innerhalb eines Monats nach dem Datum der Absendung dieses internationalen Recherchenberichts eine Stellungnahme vorlegen.

6. Folgende Abbildung der Zeichnungen ist mit der Zusammenfassung zu veröffentlichen: Abb. Nr.           

☐ wie vom Anmelder vorgeschlagen

☐ weil der Anmelder selbst keine Abbildung vorgeschlagen hat.

☐ weil diese Abbildung die Erfindung besser kennzeichnet.

☐ keine der Abb.

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**

# VERTRAG ÜBER INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

## PCT

REC'D 09 NOV 2001

### INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT PCT



(Artikel 36 und Regel 70 PCT)

|  |  |   |
|--|--|---|
| Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts<br><b>LEA33917-WO</b>  | <b>WEITERES VORGEHEN</b> siehe Mitteilung über die Übersendung des internationalen vorläufigen Prüfungsberichts (Formblatt PCT/IPEA/416) |   |
| Internationales Aktenzeichen<br><b>PCT/EP00/07096</b>  | Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr)<br><b>25/07/2000</b>   | Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr)<br><b>06/08/1999</b> |
| Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK<br><b>C07D409/12</b> |  |   |
| Anmelder<br><b>BAYER AKTIENGESELLSCHAFT et al.</b>   |  |   |

- Dieser internationale vorläufige Prüfungsbericht wurde von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde erstellt und wird dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt.
- Dieser BERICHT umfaßt insgesamt 8 Blätter einschließlich dieses Deckblatts.  
  
☐ Außerdem liegen dem Bericht ANLAGEN bei; dabei handelt es sich um Blätter mit Beschreibungen, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit vor dieser Behörde vorgenommenen Berichtigungen (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsrichtlinien zum PCT).  
  
 Diese Anlagen umfassen insgesamt Blätter.

3. Dieser Bericht enthält Angaben zu folgenden Punkten:

- I ☒ Grundlage des Berichts
- II ☐ Priorität
- III ☐ Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit
- IV ☐ Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung
- V ☒ Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung
- VI ☐ Bestimmte angeführte Unterlagen
- VII ☐ Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung
- VIII ☐ Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung

|   |   |
|---|---|
| Datum der Einreichung des Antrags<br><br><b>20/12/2000</b>  | Datum der Fertigstellung dieses Berichts<br><br><b>08.11.2001</b>   |
| Name und Postanschrift der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde:<br><br> <b>Europäisches Patentamt - P.B. 5818 Patentlaan 2<br/>NL-2280 HV Rijswijk - Pays Bas<br/>Tel. +31 70 340 - 2040 Tx: 31 651 epo nl<br/>Fax: +31 70 340 - 3016</b> | Bevollmächtigter Bediensteter<br><br><b>Paisdor, B</b><br><br>Tel. Nr. +31 70 340 3764<br><br> |

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**

**I. Grundlag des Berichts**

1. Hinsichtlich der **Bestandteile** der internationalen Anmeldung (*Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich eingereicht" und sind ihm nicht beigelegt, weil sie keine Änderungen enthalten (Regeln 70.16 und 70.17)*):  
**Beschreibung, Seiten:**

1-50                      ursprüngliche Fassung

**Patentansprüche, Nr.:**

1-9                      ursprüngliche Fassung

2. Hinsichtlich der **Sprache**: Alle vorstehend genannten Bestandteile standen der Behörde in der Sprache, in der die internationale Anmeldung eingereicht worden ist, zur Verfügung oder wurden in dieser eingereicht, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.

Die Bestandteile standen der Behörde in der Sprache: zur Verfügung bzw. wurden in dieser Sprache eingereicht; dabei handelt es sich um

- ☐ die Sprache der Übersetzung, die für die Zwecke der internationalen Recherche eingereicht worden ist (nach Regel 23.1(b)).
- ☐ die Veröffentlichungssprache der internationalen Anmeldung (nach Regel 48.3(b)).
- ☐ die Sprache der Übersetzung, die für die Zwecke der internationalen vorläufigen Prüfung eingereicht worden ist (nach Regel 55.2 und/oder 55.3).

3. Hinsichtlich der in der internationalen Anmeldung offenbarten **Nucleotid- und/oder Aminosäuresequenz** ist die internationale vorläufige Prüfung auf der Grundlage des Sequenzprotokolls durchgeführt worden, das:

- ☐ in der internationalen Anmeldung in schriftlicher Form enthalten ist.
- ☐ zusammen mit der internationalen Anmeldung in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.
- ☐ bei der Behörde nachträglich in schriftlicher Form eingereicht worden ist.
- ☐ bei der Behörde nachträglich in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.
- ☐ Die Erklärung, daß das nachträglich eingereichte schriftliche Sequenzprotokoll nicht über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung im Anmeldezeitpunkt hinausgeht, wurde vorgelegt.
- ☐ Die Erklärung, daß die in computerlesbarer Form erfassten Informationen dem schriftlichen Sequenzprotokoll entsprechen, wurde vorgelegt.

4. Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:

- ☐ Beschreibung,              Seiten:
- ☐ Ansprüche,                  Nr.:
- ☐ Zeichnungen,                Blatt:

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**



# INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT

Internationales Aktenzeichen PCT/EP00/07096

5. ☐ Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der Änderungen erstellt worden, da diese aus den angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2(c)).

*(Auf Ersatzblätter, die solche Änderungen enthalten, ist unter Punkt 1 hinzuweisen; sie sind diesem Bericht beizufügen).*

6. Etwaige zusätzliche Bemerkungen:

## V. Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

### 1. Feststellung

|                                |                 |     |
|--------------------------------|-----------------|-----|
| Neuheit (N)                    | Ja: Ansprüche   |     |
|                                | Nein: Ansprüche | 1-9 |
| Erfinderische Tätigkeit (ET)   | Ja: Ansprüche   |     |
|                                | Nein: Ansprüche | 1-9 |
| Gewerbliche Anwendbarkeit (GA) | Ja: Ansprüche   | 1-9 |
|                                | Nein: Ansprüche |     |

### 2. Unterlagen und Erklärungen siehe Beiblatt

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**

## **Zu Punkt V**

Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) PCT hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

### **2. Unterlagen und Erklärungen**

Es wird auf die folgenden Dokumente verwiesen:

- D1: EP-A-0 030 142 (DU PONT) 10. Juni 1981 (1981-06-10) in der Anmeldung erwähnt
- D2: US-A-4 481 029 (LEVITT GEORGE) 6. November 1984 (1984-11-06) in der Anmeldung erwähnt

#### **2.1 Neuheit (Artikel 33(2) PCT)**

2.1.1 Der Gegenstand des unabhängigen Anspruches 1 der vorliegenden Anmeldung ist nicht neu im Sinne von Artikel 33(2) PCT, da Thienylverbindungen gemäß Formel I des Anspruches 1, in welchen "Q" für eine Einfachbindung steht, in Dokument D1 in Listen genannt sind. Lediglich Verbindungen von Anspruch 1 der vorliegenden Anmeldungen in denen "Q" für NH steht, sind im Stand der Technik nicht genannt.

2.1.2 Zwar werden Thienyl(aminosulfonyl)harnstoffderivate mit mindestens einem Halogen oder (subst.)Alkyl Substituenten in D1 und D2 **nicht als Beispiel** genannt, jedoch sind in den Tabellen IV-e von D1 (vgl. Seite 100, Zeilen 15-17), IV-c von D2 (vgl. Spalte 71, Zeile 68 - Spalte 72, Zeile 13) Pyrimidinverbindungen **explizit** genannt, die unter Anspruch 1 der vorliegenden Anmeldung fallen. Ein Fachmann ist mit den in D1 angegebenen Informationen in der Lage, diese Verbindungen einfach herzustellen ohne erfinderischen Aufwand betreiben zu müssen (vgl. Synthesebeispiele 1-8 von D1, Seiten 55-59, sowie allgemeine Synthesemethoden der in D1 genannten Verbindungen auf Seiten 22 - 54). Gleiches gilt für D2 (vgl. Spalten 33 - 36, bzw. Spalten 14 - 33 für

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**

die allgemeine Synthese).

2.1.3 Demnach erfüllen der unabhängige Anspruch 1, sowie die abhängigen Produktansprüche 2-4 das Kriterium der Neuheit nicht (Artikel 33(2) PCT). Da die Dokumente D1 und D2 auch Herbizide und Mittel zur Regulation des Pflanzenwuchses offenbaren, sind auch die unabhängigen Ansprüche 7 - 9 bezüglich der herbiziden Verwendung von Verbindungen gemäß Anspruch 1 der vorliegenden Anmeldung nicht neu. Weiterhin erfüllt der unabhängige Anspruch 6 der vorliegenden Anmeldung nicht das Kriterium der Neuheit im Sinne von Artikel 33(2) PCT (vgl. z.B. D2, Spalte 34, Beispiel 3 in Verbindung mit Tabelle IV-C (Spalte 71)).

2.1.4 Salze der Verbindungen gemäß den Ansprüchen 1-4 wie sie in Anspruch 5 der vorliegenden Anmeldung definiert werden, sind in den oben genannten Dokumenten ebenfalls beansprucht (vgl. z.B. D1, Anspruch 29). Der Gegenstand von Anspruch 5 erfüllt daher, unter Anwendung der für die Ansprüche 1-4 vorgebrachte Argumentation, nicht das Erfordernis der Neuheit.

## **2.2 Erfinderische Tätigkeit (Artikel 33(3) PCT)**

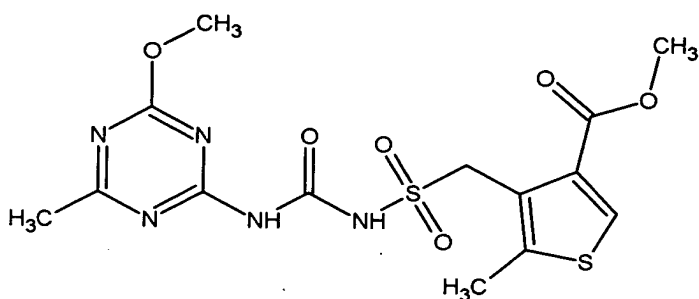
Eine endgültige Beurteilung der erfinderischen Tätigkeit kann zum gegenwärtigen Zeitpunkt nicht durchgeführt werden, da der Gegenstand des Hauptanspruches 1 nicht das Erfordernis der Neuheit erfüllt. Daher wird die vorläufige Beurteilung abgegeben, nach der die im unabhängigen Anspruch 1 der vorliegenden Anmeldung vorgeschlagene Lösung aus folgenden Gründen nicht als erfinderisch betrachtet werden (Artikel 33(3) PCT) kann:

2.2.1 Der Teil der Produktansprüche 1 - 4, des Verfahrensanspruches 6 und der Verwendungsansprüche 7-9, der neuheitsschädlich durch die Offenbarung von D1 und D2 getroffen wird erfüllt nicht die Bestimmungen von Artikel 33(1) PCT und ist auch nicht erfinderisch im Sinne von Artikel 33(3).

2.2.2 Für den nicht neuheitsschädlich von D1 getroffenen Teil des Hauptanspruches 1 ist D1 als nächstliegender Stand der Technik anzusehen. Das

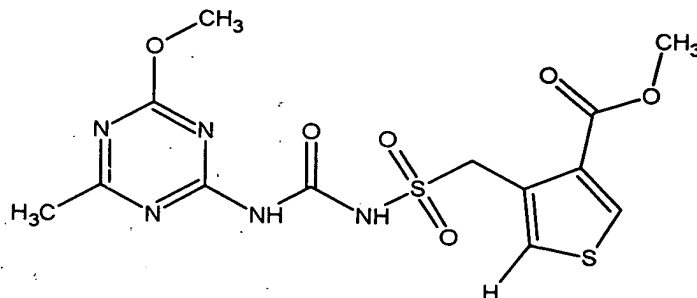
**THIS PAGE BLANK (USPTO)**

unterscheidende strukturelle/technische Merkmal zwischen den nicht neuheitsschädlich durch D1/D2 getroffenen herbiziden Verbindungen der vorliegenden Anmeldung und den in D1 offenbarten herbiziden Thiophenderivaten besteht zum Beispiel darin, daß in Thiophenderivaten gemäß Formel I von Anspruch 1 der vorliegenden Anmeldung, in denen "A" für Stickstoff steht, der Thiophenring zusätzlich mit einer Alkylgruppe substituiert ist. Zum direkten Vergleich können Beispiel 1 der vorliegenden Anmeldung und die Verbindung in Tabelle B, Seite 201 miteinander verglichen werden.



Beispiel 1 d. vorliegenden  
Anmeldung

Beispiel von D1, Seite 201



2.2.3 Die dem Hauptanspruch 1 zugrunde liegende technische Aufgabe (soweit die neuheitsschädlich nicht getroffenen Verbindungen betroffen sind) besteht in der Bereitstellung weiterer Thiophenderivate als herbizide Mittel.

2.2.4 Diese Aufgabe ist angesichts der Offenbarung von D1 und D2 als naheliegend anzusehen und daher nicht erfinderisch im Sinne von Artikel 33(3) PCT. Der Fachmann musste lediglich den Alkylsubstituenten, der in Anspruch 1 von D1 als dritter Substituent des Thienylringes bereits angegeben (vgl. Formel III von Anspruch 1, D1, Bedeutung der Gruppe A', Zeilen 10 - 15), und welcher in den Pyrimidinanaloga

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**



der Tabelle IV-e (vgl. Seite 100, Zeilen 15-17) bereits vorhanden ist, in die Verbindung von Seite 201 von D1 übernehmen.

2.2.5 Demnach besteht der Gegenstand des Anspruchs 1 in der Auswahl einer weiteren Substitution (Alkyl oder Halogen) am Thienylring aus dem in Dokument D1 beschriebenen Bereich. Eine solche Auswahl kann jedoch nur dann als erfinderisch angesehen werden, wenn der zusätzliche Substituent unerwartete Wirkungen oder Eigenschaften gegenüber dem Rest des Bereichs aufweist. Derartige Wirkungen oder Eigenschaften sind jedoch in der Anmeldung nicht angegeben. Dem Gegenstand des Anspruchs 1 liegt daher keine erfinderische Tätigkeit zugrunde. Zum Nachweis von für den Fachmann unerwarteten Eigenschaften der getroffenen Auswahl aus dem weiteren Bereich des Standes der Technik sollte vermutlich ein Vergleich der biologischen, bzw. herbiziden Eigenschaften von Verbindungen, die sich lediglich durch das ausgewählte strukturelle Merkmal unterscheiden, durchgeführt werden. Ein Vergleich der in Punkt 2.2.2 genannten Verbindungen wäre beispielsweise geeignet zum Nachweis eines unerwarteten Effektes der getroffenen Auswahl.

2.2.6 Die abhängigen Produktansprüche 2-5, die unabhängigen Ansprüche 7 - 9 (herbizide Verwendung von Verbindungen gemäß Anspruch 1 der vorliegenden Anmeldung), sowie der unabhängige Anspruch 6 (Herstellung der Endprodukte nach Anspruch 1) - insoweit der Gegenstand dieser Ansprüche nicht neuheitsschädlich von D1 und D2 getroffen wird - enthält keine weiteren technischen Merkmale die relevant für die Beurteilung der erfinderischen Tätigkeit sind. Damit erfüllen auch diese Ansprüche nicht das Kriterium der erfinderischen Tätigkeit im Sinne von Artikel 33(3) PCT.

### **2.3 Industrielle Anwendbarkeit (Artikel 33(4) PCT)**

Die in der vorliegenden Anmeldung beanspruchten Verbindungen sind geeignet zur Herstellung von herbiziden Mitteln zur Unkrautbekämpfung. Damit sind die Bestimmungen von Artikel 33(4) PCT erfüllt.

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**

**INTERNATIONALER VORLÄUFIGER  
PRÜFUNGSBERICHT - BEIBLATT**

---

Internationales Aktenzeichen PCT/EP00/07096

B. Paisdor

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**